

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2004-137157

(P2004-137157A)

(43) 公開日 平成16年5月13日 (2004.5.13)

(51) Int.Cl.<sup>7</sup>

F I

テーマコード (参考)

A 6 1 K 31/52

A 6 1 K 31/52

4 C 0 8 6

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 31/14

A 6 1 P 31/14

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 31/20

A 6 1 P 31/20

審査請求 未請求 請求項の数 10 O L (全 133 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2002-301195 (P2002-301195)

(22) 出願日 平成14年10月16日 (2002.10.16)

(71) 出願人 000183370

住友製薬株式会社

大阪府大阪市中央区道修町2丁目2番8号

(74) 代理人 100121588

弁理士 五十部 穰

(72) 発明者 磯部 義明

兵庫県西宮市丸橋町4-15-106

(72) 発明者 荻田 晴久

大阪府豊中市曽根東町2-10-4-45

O

(72) 発明者 戸辺 雅則

大阪府豊中市曽根東町2-10-2-25

1

(72) 発明者 高久 春雄

兵庫県西宮市丸橋町4-15-104

最終頁に続く

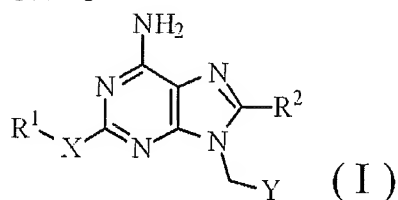
(54) 【発明の名称】 新規アデニン誘導体を有効成分として含有する医薬

(57) 【要約】

【課題】 種々のウイルス性疾患、癌疾患あるいは炎症性疾患に対する治療に有用な医薬を提供する。

【解決手段】 一般式 (I) :

【化1】



10

〔式中、Xは、NR<sup>3</sup> (R<sup>3</sup>は水素原子若しくは炭素数1～3のアルキル基)等を表し；R<sup>1</sup>は、置換若しくは非置換のアルキル基等を表し；R<sup>2</sup>は、水酸基等を表し；Yは、置換若しくは非置換の芳香族ヘテロ環等を表す。〕で示されるアデニン誘導体若しくはその互変異性体又はそれらの薬学的に許容される塩、及び、これを有効成分とする、インターフェロン誘導剤、抗ウイルス剤、抗癌剤、タイプ2ヘルパーT細胞選択的免疫応答抑制剤、抗アレルギー剤及び免疫応答調節剤等の医薬。

【選択図】 なし。

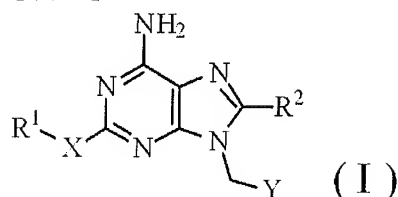
20

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I) :

【化 1】



10

〔式中、Xは、NR<sup>3</sup> (R<sup>3</sup>は水素原子若しくは炭素数1～3のアルキル基)、酸素原子、又は硫黄原子を表し；R<sup>1</sup>は、置換若しくは非置換のアルキル基、置換若しくは非置換のアルケニル基、置換若しくは非置換のアルキニル基、置換若しくは非置換のアリール基、又は置換若しくは非置換のヘテロアリール基を表し；R<sup>2</sup>は、水酸基、メルカプト基、炭素数1～8のアシルオキシ基、又は炭素数2～8のアルコキシカルボニルオキシ基を表し；Yは、置換若しくは非置換のナフタレン環か、置換若しくは非置換の、窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子を含む5又は6員単環芳香族ヘテロ環か、或いは、置換若しくは非置換の、窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子を含む縮合2環性芳香族ヘテロ環を表す。〕で示されるアデニン誘導体若しくはその互変異性体又はそれらの薬学的に許容される塩を有効成分として含有する医薬。

20

【請求項 2】

一般式 (I) において、R<sup>1</sup>が炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数2～8のアルキニル基、炭素数2～8のアルコキシアルキル基、炭素数1～8のヒドロキシアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、アラルキル基、又はヘテロアリールアルキル基である請求項1に記載の医薬。

【請求項 3】

一般式 (I) において、R<sup>1</sup>が炭素数1～6のアルキル基である請求項1に記載の医薬。

【請求項 4】

一般式 (I) において、Xが、NHである請求項1～3のいずれかに記載の医薬。

30

【請求項 5】

一般式 (I) において、Xが、酸素原子である請求項1～3のいずれかに記載の医薬。

【請求項 6】

一般式 (I) において、Yが、非置換若しくは置換のピリジン環又は置換若しくは非置換のピラジン環である請求項1～5のいずれかに記載の医薬。

【請求項 7】

一般式 (I) において、Yが、非置換若しくは置換のナフタレン環又は置換若しくは非置換のチオフェン環である請求項1～5のいずれかに記載の医薬。

【請求項 8】

一般式 (I) において、Yが、炭素数1～4のアルキル基、炭素数1～4のアルコキシ基、水酸基、メルカプト基、炭素数1～4のアルキルチオ基、ハロゲン原子、アミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数1～4のモノアルキルアミノ基、ピロリジニル基、ピペリジノ基及びモルホリノ基からなる群から選択される1又は複数の置換基を有する請求項1～7のいずれかに記載の医薬。

40

【請求項 9】

一般式 (I) において、Yが、炭素数1～4のアルキル基、炭素数1～4のアルコキシ基、水酸基、メルカプト基、炭素数1～4のアルキルチオ基、ハロゲン原子、アミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数1～4のモノアルキルアミノ基、ピロリジニル基、ピペリジノ基及びモルホリノ基からなる群から選択される置換基を有していてもよい

50

ピリジン環であり、 $R^1$  が炭素数 1 ～ 6 のアルキル基であり、 $R^2$  が水酸基である請求項 1 に記載の医薬。

【請求項 10】

X が NH または酸素原子である請求項 9 に記載の医薬。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は、B 型及び C 型肝炎、エイズなどのウイルス疾患、癌疾患などの予防又は治療に対して有用なアデニン誘導体、並びにこれを有効成分とする、インターフェロン誘導剤、抗ウイルス剤、抗癌剤、タイプ 2 ヘルパー T 細胞選択的免疫応答抑制剤、抗アレルギー剤及び免疫応答調節剤等の医薬に関する。

【0002】

【従来の技術】

インターフェロンは感染防御や免疫調節を担う最も重要な因子の一つであり、B 型及び C 型肝炎治療剤、或いは癌免疫療法剤として既に実用化されている。特に C 型肝炎においては事実上唯一の治療薬となっている。インターフェロンは分子量約 2 万のポリペプチドであり、遺伝子組換え法あるいは細胞培養法によって製造され、注射によってのみが投与可能である。従って、経口投与可能なインターフェロン誘導剤が望まれている。

これまでインターフェロン誘発作用を持つ物質としては、ウイルスや他の生物由来の二本鎖核酸、ポリ (I) : ポリ (C) やポリカルボキシレートなどの高分子ポリマーが知られているが、二本鎖核酸や高分子ポリマーは、抗原性や病原微生物による汚染の危険、生物学的安定性等で問題がある上、高分子であるため経口剤としての開発は困難である。低分子インターフェロン誘導物質として、フルオレノン類、ピリミジノン類、アントラキノン類など幾つかのものが検討されてきたが (非特許文献 1、2、及び 3)、治療効果が低く、或いはその毒性のため医薬品としての開発は断念されてきた (非特許文献 4)。別の低分子インターフェロン誘導物質として、イミダゾキノリン誘導体である R-837 (イミキモド) も知られているが (特許文献 1)、R-837 のインターフェロン誘導活性は低く、副作用のため経口剤分野での開発は中止されている。我々も特定のプリン誘導体にインターフェロン誘導作用があることを見出した (特許文献 2)。しかし、これらの化合物は水溶性が低いために、消化管吸収率の点で必ずしも十分ではなかった。

【0003】

一方、免疫応答において中心的役割を担っているのはヘルパー T 細胞である。ヘルパー T 細胞には Th1 細胞と Th2 細胞の 2 種類があり、Th1 細胞の活性化に伴い産生されるサイトカインにはインターロイキン-2 (IL-2) やインターフェロン- $\gamma$  (IFN- $\gamma$ ) などがあり、Th2 細胞から産生されるものには、インターロイキン-4 (IL-4) やインターロイキン-5 (IL-5) などがある。Th1 側サイトカインはマクロファージやナチュラルキラー細胞などの活性化を起こし、主にウイルス、バクテリアなどに対する感染防御などの細胞性免疫に関与していることが知られている。Th2 側サイトカインは B 細胞からの抗体産生などの液性免疫に関与している。特に IL-4 は B 細胞に IgE 抗体の産生を誘導させるほか、Th2 細胞の分化増殖作用を有する。IL-5 は好酸球の活性化、分化増殖促進、寿命延長などの作用を有しており、アレルギー性炎症でしばしば重要な役割を果たしている。実際に喘息、アトピー性皮膚炎など Th2 細胞を主体とするアレルギー性炎症の患者の患部においてはこれらの Th2 側サイトカインの増加が認められている。これらの疾患の治療にはステロイド剤がしばしば使用されるが、ステロイド剤の長期投与は広範な副作用 (糖尿病、骨粗鬆症、副腎機能不全、ムーンフェイスなど) が発現してしまうことが問題である。またステロイド剤は Th1 および Th2 いずれの T 細胞に対しても抑制的に作用するため、Th1 細胞を抑制した結果として感染症を引き起こすことがある。以上より Th2 側の免疫応答を選択的に抑制する薬剤は、感染症を起こすことなく安全なアレルギー疾患の治療薬となることが期待できる。

【0004】

## 【非特許文献1】

Mayer, G. D. ら、「Science」, 169, 1214 (1970.)」

## 【非特許文献2】

Nichol, F. R. ら、「Antimicrob. Agents Chemother.」, 9, 433 (1976)」

## 【非特許文献3】

Stringfellow, D. A. ら、「Antimicrob. Agents Chemother.」, 15, 111 (1991)」

## 【非特許文献4】

Reiter, M. A. ら、「J. Leukocyte Biol.」, 55, 21034 (1994)」

## 【特許文献1】

欧州特許出願公開第145340号明細書

## 【特許文献2】

国際公開第99/28321号パンフレット

## 【0005】

## 【発明が解決しようとする課題】

前記状況に鑑み、本発明の目的は、B型及びC型肝炎、エイズなどのウイルス疾患、癌疾患およびタイプ2ヘルパーT細胞を起因とする疾患などの予防又は治療に対して有効で、経口投与が可能な低分子であって、さらに物性（例えば溶解度、体内動態など）を向上させた化合物を提供することにある。 20

## 【0006】

## 【課題を解決するための手段】

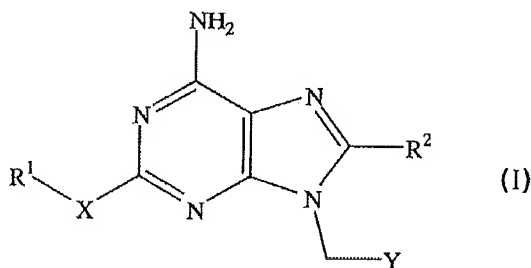
かかる背景から、本発明者らは鋭意検討した結果、特定構造を有するアデニン誘導体が、際だったインターフェロン誘導活性およびタイプ2ヘルパーT細胞選択的免疫応答抑制作用を有するとともに、物性面で優れていることを見だし、本発明を完成するに至った。

## 【0007】

即ち、本発明は以下の発明を包含する。

(1) 一般式(I)：

【化2】



〔式中、Xは、NR<sup>3</sup>（R<sup>3</sup>は水素原子若しくは炭素数1～3のアルキル基）、酸素原子、又は硫黄原子を表し；R<sup>1</sup>は、置換若しくは非置換のアルキル基、置換若しくは非置換のアルケニル基、置換若しくは非置換のアルキニル基、置換若しくは非置換のアリール基、又は置換若しくは非置換のヘテロアリール基を表し；R<sup>2</sup>は、水酸基、メルカプト基、炭素数1～8のアシルオキシ基、又は炭素数2～8のアルコキシカルボニルオキシ基を表し；Yは、置換若しくは非置換のナフタレン環か、置換若しくは非置換の、窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子を含む5又は6員単環芳香族ヘテロ環か、或いは、置換若しくは非置換の、窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子を含む縮合2環性 50



芳香族ヘテロ環を表す。)で示されるアデニン誘導体若しくはその互変異性体又はそれらの薬学的に許容される塩。

(2) 前記一般式(1)において、 $R^1$ が炭素数1~8のアルキル基、炭素数2~8のアルケニル基、炭素数2~8のアルキニル基、炭素数2~8のアルコキシアルキル基、炭素数1~8のヒドロキシアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、アラルキル基、又はヘテロアリールアルキル基である前記(1)に記載の化合物。

(3) 前記一般式(1)において、 $R^1$ が炭素数1~6のアルキル基である前記(1)又は(2)に記載の化合物。

(4) 前記一般式(1)において、Xが、NHである前記(1)~(3)のいずれかに記載の化合物。

(5) 前記一般式(1)において、Xが、酸素原子である前記(1)~(3)のいずれかに記載の化合物。

(6) 前記一般式(1)において、Yが、非置換若しくは置換のピリジン環又は置換若しくは非置換のピラジン環である前記(1)~(5)のいずれかに記載の化合物。

(7) 前記一般式(1)において、Yが、非置換若しくは置換のナフタレン環又は置換若しくは非置換のチオフェン環である前記(1)~(5)のいずれかに記載の化合物。

(8) 前記一般式(1)において、Yが、炭素数1~4のアルキル基、炭素数1~4のアルコキシ基、水酸基、メルカプト基、炭素数1~4のアルキルチオ基、ハロゲン原子、アミノ基、炭素数2~8のジアルキルアミノ基、炭素数1~4のモノアルキルアミノ基、ピロリジニル基、ピペリジノ基及びモルホリノ基からなる群から選択される置換基を、該Yがピリジン環の場合は1~4個、該Yがピラジン環の場合は1~3個任意の位置に有する前記(1)~(6)のいずれかに記載の化合物。

(9) 前記一般式(1)において、Yが、炭素数1~4のアルキル基、炭素数1~4のアルコキシ基、水酸基、メルカプト基、炭素数1~4のアルキルチオ基、ハロゲン原子、アミノ基、炭素数2~8のジアルキルアミノ基、炭素数1~4のモノアルキルアミノ基、ピロリジニル基、ピペリジノ基及びモルホリノ基からなる群から選択される置換基を有していてもよいピリジン環であり、 $R^1$ が炭素数1~6のアルキル基であり、 $R^2$ が水酸基である前記(1)~(6)、(8)のいずれかに記載の化合物。

(10) Xが NH 又は酸素原子である(9)記載の化合物。

(11) 前記(1)~(10)のいずれかに記載の化合物を有効成分とする医薬。

(12) 前記(1)~(10)のいずれかに記載の化合物を有効成分とするインターフェロン誘導剤。

(13) 前記(1)~(10)のいずれかに記載の化合物を有効成分とする抗ウイルス剤。

(14) 前記(1)~(10)のいずれかに記載の化合物を有効成分とする抗癌剤。

(15) 前記(1)~(10)のいずれかに記載の化合物を有効成分とするタイプ2ヘルパーT細胞選択的免疫応答抑制剤。

(16) 前記(1)~(10)のいずれかに記載の化合物を有効成分とする抗アレルギー剤。

(17) 前記(1)~(10)のいずれかに記載の化合物を有効成分とする免疫応答調節剤。

#### 【0008】

以下、本発明の化合物について詳細に説明する。

一般式(1)において、 $R^1$ におけるアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基としては炭素数1~8のアルキル基、炭素数2~8のアルケニル基、炭素数2~8のアルキニル基が好ましい。さらに、 $R^1$ におけるアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の置換基としては、水酸基、炭素数1~8のアルコキシ基、アリール基、ヘテロアリール基、ハロゲン原子(塩素、フッ素、臭素、沃素等)を挙げることができ、特に、 $R^1$ における置換のアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基としては炭素数2~8のアルコキシアルキル基、炭素数1~8のヒドロキシアルキル基、アラルキル基、及びヘテロアリ

10

20

30

40

50

ールアルキル基等が好ましい。

前記炭素数 1～8 のアルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、1-プロピル基、2-プロピル基、1-ブチル基、2-ブチル基、1-ペンチル基、2-ペンチル基、1-ヘキシル基、2-ヘキシル基、1-ヘプチル基、2-ヘプチル基、3-ヘプチル基、オクチル基、2-メチルプロピル基、2-メチルブチル基、3-メチルブチル基、2-メチルペンチル基、3-メチルペンチル基、4-メチルペンチル基、メチルヘキシル基、メチルヘプチル基、1, 1-ジメチルエチル基、1, 1-ジメチルプロピル基、2-エチルヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、メチルシクロペンチル基、シクロヘキシル基、メチルシクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基などが挙げられる。

10

前記炭素数 2～8 のアルケニル基としては、例えばビニル基、アリル基、クロチル基、1-プロペニル基、シクロペンテニル基、シクロペンタジエニル基、シクロヘキセニル基などが挙げられる。

前記炭素数 2～8 のアルキニル基としては、例えばエチニル基、プロピニル基、ブチニル基などが挙げられる。

【0009】

前記炭素数 1～8 のヒドロキシアルキル基としては、例えば1-ヒドロキシエチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシプロピル基、2-ヒドロキシプロピル基、3-ヒドロキシプロピル基、1-ヒドロキシブチル基、2-ヒドロキシブチル基、3-ヒドロキシブチル基、4-ヒドロキシブチル基などが挙げられる。

20

前記アラルキル基としては、例えばベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、フェニルプロピル基、フェニルブチル基などが挙げられる。

前記ヘテロアリーールアルキル基としては、4-ピリジルメチル基、3-ピリジルメチル基などが挙げられる。

前記炭素数 2～8 のアルコキシアルキル基としては、例えばメトキシメチル基、2-メトキシエチル基、3-メトキシプロピル基、4-メトキシブチル基、エトキシメチル基、2-エトキシエチル基、3-エトキシプロピルなどが挙げられる。

なお、上で示した  $R^1$  で表される各置換基は、アルキル基、ヒドロキシル基、メルカプト基、ハロゲン原子、アミノ基、アルコキシ基等の置換基を有していてもよい。

【0010】

30

また一般式 (1) において、 $R^1$  におけるアリーール基またはヘテロアリーール基としては、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、2-ピラジニル基、3-ピラジニル基、2-ピリミジニル基、4-ピリミジニル基、5-ピリミジニル基、2-フリル基、3-フリル基、2-チエニル基、3-チエニル基などが挙げられる。上記アリーール基またはヘテロアリーール基は非置換あるいは置換基を有していてもよく、置換基としては炭素数 1～4 のアルキル基、炭素数 1～4 のアルコキシ基、水酸基、メルカプト基、炭素数 1～4 のアルキルチオ基、ハロゲン原子、アミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 1～4 のモノアルキルアミノ基、メチレンジオキシ基等が挙げられる。前記炭素数 1～4 のアルキル基としては、メチル基、エチル基、1-プロピル基、2-プロピル基、1-ブチル基、2-ブチル基などを挙げることができる。炭素数 1～4 のアルコキシ基としては、メトキシ基、エトキシ基、1-プロポキシ基、2-プロポキシ基、1-ブトキシ基、2-ブトキシ基などを挙げることができる。前記炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基としては、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ジプロピルアミノ基、ジブチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、メチルプロピルアミノ基などを挙げることができる。前記炭素数 1～4 のモノアルキルアミノ基としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、ブチルアミノ基などを挙げることができる。前記炭素数 1～4 のアルキルチオ基としては、メチルチオ基、エチルチオ基、1-プロピルチオ基、2-プロピルチオ基、1-ブチルチオ基、2-ブチルチオ基、 $t$ -ブチルチオ基などが挙げられる。前記ハロゲン原子としては、フッ素、塩素、臭素が挙げられる。

40

50

置換基を有する  $R^1$  におけるアリール基またはヘテロアリール基としては、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-エチルフェニル基、3-エチルフェニル基、4-エチルフェニル基、2-プロピルフェニル基、3-プロピルフェニル基、4-プロピルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-ブチルフェニル基、3-ブチルフェニル基、4-ブチルフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-エトキシフェニル基、3-エトキシフェニル基、4-エトキシフェニル基、2-プロポキシフェニル基、3-プロポキシフェニル基、4-プロポキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-ブトキシフェニル基、3-ブトキシフェニル基、4-ブトキシフェニル基、2-メチルアミノフェニル基、3-メチルアミノフェニル基、4-メチルアミノフェニル基、2-エチルアミノフェニル基、3-エチルアミノフェニル基、4-エチルアミノフェニル基、2-プロピルアミノフェニル基、3-プロピルアミノフェニル基、4-プロピルアミノフェニル基、2-イソプロピルアミノフェニル基、3-イソプロピルアミノフェニル基、4-イソプロピルアミノフェニル基、2-ブチルアミノフェニル基、3-ブチルアミノフェニル基、4-ブチルアミノフェニル基、2-ジメチルアミノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、2-ジエチルアミノフェニル基、3-ジエチルアミノフェニル基、4-ジエチルアミノフェニル基、2-ジプロピルアミノフェニル基、3-ジプロピルアミノフェニル基、4-ジプロピルアミノフェニル基、2-ジブチルアミノフェニル基、3-ジブチルアミノフェニル基、4-ジブチルアミノフェニル基、2-エチルメチルアミノフェニル基、3-エチルメチルアミノフェニル基、4-エチルメチルアミノフェニル基、2-メチルチオフェニル基、3-メチルチオフェニル基、4-メチルチオフェニル基、2-エチルチオフェニル基、3-エチルチオフェニル基、4-エチルチオフェニル基、2-プロピルチオフェニル基、3-プロピルチオフェニル基、4-プロピルチオフェニル基、2-イソプロピルチオフェニル基、3-イソプロピルチオフェニル基、4-イソプロピルチオフェニル基、2-ブチルチオフェニル基、3-ブチルチオフェニル基、4-ブチルチオフェニル基、2-メチル-1-ナフチル基、3-メチル-1-ナフチル基、4-メチル-1-ナフチル基、5-メチル-1-ナフチル基、6-メチル-1-ナフチル基、7-メチル-1-ナフチル基、8-メチル-1-ナフチル基、1-メチル-2-ナフチル基、3-メチル-2-ナフチル基、4-メチル-2-ナフチル基、5-メチル-2-ナフチル基、6-メチル-2-ナフチル基、7-メチル-2-ナフチル基、8-メチル-2-ナフチル基、2-メトキシ-1-ナフチル基、3-メトキシ-1-ナフチル基、4-メトキシ-1-ナフチル基、5-メトキシ-1-ナフチル基、6-メトキシ-1-ナフチル基、7-メトキシ-1-ナフチル基、8-メトキシ-1-ナフチル基、1-メトキシ-2-ナフチル基、3-メトキシ-2-ナフチル基、4-メトキシ-2-ナフチル基、5-メトキシ-2-ナフチル基、6-メトキシ-2-ナフチル基、7-メトキシ-2-ナフチル基、8-メトキシ-2-ナフチル基、2-エトキシ-1-ナフチル基、3-エトキシ-1-ナフチル基、4-エトキシ-1-ナフチル基、5-エトキシ-1-ナフチル基、6-エトキシ-1-ナフチル基、7-エトキシ-1-ナフチル基、8-エトキシ-1-ナフチル基、1-エトキシ-2-ナフチル基、3-エトキシ-2-ナフチル基、4-エトキシ-2-ナフチル基、5-エトキシ-2-ナフチル基、6-エトキシ-2-ナフチル基、7-エトキシ-2-ナフチル基、8-エトキシ-2-ナフチル基、2-ヒドロキシ-1-ナフチル基、3-ヒドロキシ-1-ナフチル基、4-ヒドロキシ-1-ナフチル基、5-ヒドロキシ-1-ナフチル基、6-ヒドロキシ-1-ナフチル基、7-ヒドロキシ-1-ナフチル基、8-ヒドロキシ-1-ナフチル基、1-ヒドロキシ-2-ナフチル基、3-ヒドロキシ-2-ナフチル基、4-ヒドロキシ-2-ナフチル基、5-ヒドロキシ-2-ナフチル基、6-ヒドロキシ-2-ナフチル基、7-ヒドロキシ-2-ナフチル基、8-ヒドロキシ-2-ナフチル基、2-クロロ-1-ナフチル基、3-クロロ-1-ナフ

チル基、4-クロロ-1-ナフチル基、5-クロロ-1-ナフチル基、6-クロロ-1-  
 ナフチル基、7-クロロ-1-ナフチル基、8-クロロ-1-ナフチル基、1-クロロ-  
 2-ナフチル基、3-クロロ-2-ナフチル基、4-クロロ-2-ナフチル基、5-クロ  
 ロ-2-ナフチル基、6-クロロ-2-ナフチル基、7-クロロ-2-ナフチル基、8-  
 クロロ-2-ナフチル基、2-フルオロ-1-ナフチル基、3-フルオロ-1-ナフチル  
 基、4-フルオロ-1-ナフチル基、5-フルオロ-1-ナフチル基、6-フルオロ-1  
 -ナフチル基、7-フルオロ-1-ナフチル基、8-フルオロ-1-ナフチル基、1-フ  
 ルオロ-2-ナフチル基、3-フルオロ-2-ナフチル基、4-フルオロ-2-ナフチル  
 基、5-フルオロ-2-ナフチル基、6-フルオロ-2-ナフチル基、7-フルオロ-2  
 -ナフチル基、8-フルオロ-2-ナフチル基、2-アミノ-1-ナフチル基、3-アミ  
 ノ-1-ナフチル基、4-アミノ-1-ナフチル基、5-アミノ-1-ナフチル基、6-  
 アミノ-1-ナフチル基、7-アミノ-1-ナフチル基、8-アミノ-1-ナフチル基、  
 1-アミノ-2-ナフチル基、3-アミノ-2-ナフチル基、4-アミノ-2-ナフチル  
 基、5-アミノ-2-ナフチル基、6-アミノ-2-ナフチル基、7-アミノ-2-ナフ  
 チル基、8-アミノ-2-ナフチル基、2-メチルアミノ-1-ナフチル基、3-メチル  
 アミノ-1-ナフチル基、4-メチルアミノ-1-ナフチル基、5-メチルアミノ-1-  
 ナフチル基、6-メチルアミノ-1-ナフチル基、7-メチルアミノ-1-ナフチル基、  
 8-メチルアミノ-1-ナフチル基、1-メチルアミノ-2-ナフチル基、3-メチルア  
 ミノ-2-ナフチル基、4-メチルアミノ-2-ナフチル基、5-メチルアミノ-2-ナ  
 フチル基、6-メチルアミノ-2-ナフチル基、7-メチルアミノ-2-ナフチル基、8  
 -メチルアミノ-2-ナフチル基、2-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、3-ジメチル  
 アミノ-1-ナフチル基、4-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、5-ジメチルアミノ-  
 1-ナフチル基、6-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、7-ジメチルアミノ-1-ナフ  
 チル基、8-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、1-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、  
 3-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、4-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、5-ジメ  
 チルアミノ-2-ナフチル基、6-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、7-ジメチルアミ  
 ノ-2-ナフチル基、8-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、2-メチル-3-ピリジル  
 基、4-メチル-3-ピリジル基、5-メチル-3-ピリジル基、6-メチル-3-ピリ  
 ジル基、3-メチル-2-ピリジル基、4-メチル-2-ピリジル基、5-メチル-2-  
 ピリジル基、6-メチル-2-ピリジル基、2-メチル-4-ピリジル基、3-メチル-  
 4-ピリジル基、5-メチル-4-ピリジル基、6-メチル-4-ピリジル基、2-エチ  
 ル-3-ピリジル基、4-エチル-3-ピリジル基、5-エチル-3-ピリジル基、6-  
 エチル-3-ピリジル基、3-メチル-2-ピリジル基、4-メチル-2-ピリジル基、  
 5-メチル-2-ピリジル基、6-エチル-2-ピリジル基、2-エチル-4-ピリジル  
 基、3-エチル-4-ピリジル基、5-エチル-4-ピリジル基、6-エチル-4-ピリ  
 ジル基、2-メトキシ-3-ピリジル基、4-メトキシ-3-ピリジル基、5-メトキシ  
 -3-ピリジル基、6-メトキシ-3-ピリジル基、3-メトキシ-2-ピリジル基、4-  
 メトキシ-2-ピリジル基、5-メトキシ-2-ピリジル基、6-メトキシ-2-ピリ  
 ジル基、2-メトキシ-4-ピリジル基、3-メトキシ-4-ピリジル基、5-メトキシ  
 -4-ピリジル基、6-メトキシ-4-ピリジル基、2-エトキシ-3-ピリジル基、4  
 -エトキシ-3-ピリジル基、5-エトキシ-3-ピリジル基、6-エトキシ-3-ピリ  
 ジル基、3-エトキシ-2-ピリジル基、4-エトキシ-2-ピリジル基、5-エトキシ  
 -2-ピリジル基、6-エトキシ-2-ピリジル基、2-エトキシ-4-ピリジル基、3  
 -エトキシ-4-ピリジル基、5-エトキシ-4-ピリジル基、6-エトキシ-4-ピリ  
 ジル基、2-ヒドロキシ-3-ピリジル基、4-ヒドロキシ-3-ピリジル基、5-ヒド  
 ロキシ-3-ピリジル基、6-ヒドロキシ-3-ピリジル基、3-ヒドロキシ-2-ピリ  
 ジル基、4-ヒドロキシ-2-ピリジル基、5-ヒドロキシ-2-ピリジル基、6-ヒド  
 ロキシ-2-ピリジル基、2-ヒドロキシ-4-ピリジル基、3-ヒドロキシ-4-ピリ  
 ジル基、5-ヒドロキシ-4-ピリジル基、6-ヒドロキシ-4-ピリジル基、2-メル  
 カプト-3-ピリジル基、4-メルカプト-3-ピリジル基、5-メルカプト-3-ピリ

10

20

30

40

50

ジル基、6-メルカプト-3-ピリジル基、3-メルカプト-2-ピリジル基、4-メル  
 カプト-2-ピリジル基、5-メルカプト-2-ピリジル基、6-メルカプト-2-ピリ  
 ジル基、2-メルカプト-4-ピリジル基、3-メルカプト-4-ピリジル基、5-メル  
 カプト-4-ピリジル基、6-メルカプト-4-ピリジル基、2-メチルチオ-3-ピリ  
 ジル基、4-メチルチオ-3-ピリジル基、5-メチルチオ-3-ピリジル基、6-メチ  
 ルチオ-3-ピリジル基、3-メチルチオ-2-ピリジル基、4-メチルチオ-2-ピリ  
 ジル基、5-メチルチオ-2-ピリジル基、6-メチルチオ-2-ピリジル基、2-メチ  
 ルチオ-4-ピリジル基、3-メチルチオ-4-ピリジル基、5-メチルチオ-4-ピリ  
 ジル基、6-メチルチオ-4-ピリジル基、2-クロロ-3-ピリジル基、4-クロロ-  
 3-ピリジル基、5-クロロ-3-ピリジル基、6-クロロ-3-ピリジル基、3-クロ  
 ロ-2-ピリジル基、4-クロロ-2-ピリジル基、5-クロロ-2-ピリジル基、6-  
 クロロ-2-ピリジル基、2-クロロ-4-ピリジル基、3-クロロ-4-ピリジル基、  
 5-クロロ-4-ピリジル基、6-クロロ-4-ピリジル基、2-アミノ-3-ピリジル  
 基、4-アミノ-3-ピリジル基、5-アミノ-3-ピリジル基、6-アミノ-3-ピリ  
 ジル基、3-アミノ-2-ピリジル基、4-アミノ-2-ピリジル基、5-アミノ-2-  
 ピリジル基、6-アミノ-2-ピリジル基、2-アミノ-4-ピリジル基、3-アミノ-  
 4-ピリジル基、5-アミノ-4-ピリジル基、6-アミノ-4-ピリジル基、2-モノ  
 メチルアミノ-3-ピリジル基、4-モノメチルアミノ-3-ピリジル基、5-モノメチ  
 ルアミノ-3-ピリジル基、6-モノメチルアミノ-3-ピリジル基、3-モノメチルア  
 ミノ-2-ピリジル基、4-モノメチルアミノ-2-ピリジル基、5-モノメチルアミ  
 ノ-2-ピリジル基、6-モノメチルアミノ-2-ピリジル基、2-モノメチルアミノ-4  
 -ピリジル基、3-モノメチルアミノ-4-ピリジル基、5-モノメチルアミノ-4-ピ  
 リジル基、6-モノメチルアミノ-4-ピリジル基、2-ジメチルアミノ-3-ピリジ  
 ル基、4-ジメチルアミノ-3-ピリジル基、5-ジメチルアミノ-3-ピリジル基、6-  
 ジメチルアミノ-3-ピリジル基、3-ジメチルアミノ-2-ピリジル基、4-ジメチル  
 アミノ-2-ピリジル基、5-ジメチルアミノ-2-ピリジル基、6-ジメチルアミノ-  
 2-ピリジル基、2-ジメチルアミノ-4-ピリジル基、3-ジメチルアミノ-4-ピリ  
 ジル基、5-ジメチルアミノ-4-ピリジル基、6-ジメチルアミノ-4-ピリジル基、  
 2-フルオロ-3-ピリジル基、4-フルオロ-3-ピリジル基、5-フルオロ-3-ピ  
 リジル基、6-フルオロ-3-ピリジル基、3-フルオロ-2-ピリジル基、4-フルオ  
 ロ-2-ピリジル基、5-フルオロ-2-ピリジル基、6-フルオロ-2-ピリジル基、  
 2-フルオロ-4-ピリジル基、3-フルオロ-4-ピリジル基、5-フルオロ-4-ピ  
 リジル基、6-フルオロ-4-ピリジル基、2, 4-ジメチル-3-ピリジル基、2, 6-  
 ジメチル-3-ピリジル基、5, 6-ジメチル-3-ピリジル基、4, 6-ジメチル-  
 3-ピリジル基、4, 5-ジメチル-2-ピリジル基、5, 6-ジメチル-2-ピリジ  
 ル基、2, 3-ジメチル-4-ピリジル基、2, 6-ジメチル-4-ピリジル基、2, 4-  
 ジメトキシ-3-ピリジル基、2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル基、5, 6-ジメトキ  
 シ-3-ピリジル基、4, 6-ジメトキシ-3-ピリジル基、4, 5-ジメトキシ-2-  
 ピリジル基、5, 6-ジメトキシ-2-ピリジル基、2, 3-ジメトキシ-4-ピリジ  
 ル基、2, 6-ジメトキシ-4-ピリジル基、2-クロロ-6-メチル-3-ピリジル基、  
 6-クロロ-2-メチル-3-ピリジル基、2-クロロ-6-メトキシ-3-ピリジル基、  
 6-クロロ-2-メトキシ-3-ピリジル基、5-メチル-6-クロロ-3-ピリジル基  
 、5-メトキシ-6-クロロ-3-ピリジル基、5-エトキシ-6-クロロ-3-ピリジ  
 ル基、5-クロロ-6-メチル-3-ピリジル基、5-メトキシ-6-メチル-3-ピリ  
 ジル基、5-エトキシ-6-メチル-3-ピリジル基、5-クロロ-6-メトキシ-3-  
 ピリジル基、2-ピラジニル基、5-メチル-2-ピラジニル基、6-メチル-2-ピ  
 ラジニル基、5-メトキシ-2-ピラジニル基、6-メトキシ-2-ピラジニル基、5-  
 エトキシ-2-ピラジニル基、6-エトキシ-2-ピラジニル基、5-クロロ-2-ピラ  
 ジニル基、6-クロロ-2-ピラジニル基、3-メチル-2-フリル基、4-メチル-2

10

20

30

40

50

ーフリル基、5-メチル-2-フリル基、2-メチル-3-フリル基、4-メチル-3-  
 フリル基、5-メチル-3-フリル基、3-メトキシ-2-フリル基、4-メトキシ-2-  
 フリル基、5-メトキシ-2-フリル基、2-メトキシ-3-フリル基、4-メトキシ-  
 3-フリル基、5-メトキシ-3-フリル基、3-クロロ-2-フリル基、4-クロロ-  
 2-フリル基、5-クロロ-2-フリル基、2-クロロ-3-フリル基、4-クロロ-  
 3-フリル基、5-クロロ-3-フリル基、3-フルオロ-2-フリル基、4-フルオロ-  
 2-フリル基、5-フルオロ-2-フリル基、2-フルオロ-3-フリル基、4-フル  
 オロ-3-フリル基、5-フルオロ-3-フリル基、3-メチル-2-チエニル基、4-  
 メチル-2-チエニル基、5-メチル-2-チエニル基、2-メチル-3-チエニル基、  
 4-メチル-3-チエニル基、5-メチル-3-チエニル基、3-メトキシ-2-チエニ  
 ル基、4-メトキシ-2-チエニル基、5-メトキシ-2-チエニル基、2-メトキシ-  
 3-チエニル基、4-メトキシ-3-チエニル基、5-メトキシ-3-チエニル基、3-  
 クロロ-2-チエニル基、4-クロロ-2-チエニル基、5-クロロ-2-チエニル基、  
 2-クロロ-3-チエニル基、4-クロロ-3-チエニル基、5-クロロ-3-チエニル  
 基、3-フルオロ-2-チエニル基、4-フルオロ-2-チエニル基、5-フルオロ-2-  
 チエニル基、2-フルオロ-3-チエニル基、4-フルオロ-3-チエニル基、5-フル  
 オロ-3-チエニル基などが挙げられる。

#### 【0011】

一般式 (I) において、 $R^2$  で表される置換基としては水酸基、メルカプト基、炭素数 1  
 ～8のアシルオキシ基、又は炭素数 2～8のアルコキシカルボニルオキシ基等が挙げられ

る。  
 前記炭素数 1～8のアシルオキシ基としては、例えばホルミルオキシ基、アセチルオキシ  
 基、プロピオニルオキシ基、ブタノイルオキシ基、ペンタノイルオキシ基、ヘキサノイル  
 オキシ基、ヘプタノイルオキシ基、オクタノイルオキシ基、ベンゾイルオキシ基などが挙  
 げられる。

前記炭素数 2～8のアルコキシカルボニルオキシ基としては、例えばメトキシカルボニル  
 オキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、プロポキシカルボニルオキシ基、ブトキシカル  
 ボニルオキシ基、ペンチルオキシカルボニルオキシ基、ヘキシルオキシカルボニルオキシ  
 基、ヘプチルオキシカルボニルオキシ基、イソプロピルオキシカルボニルオキシ基、イソ  
 ブチルオキシカルボニルオキシ基、*t*-ブチルオキシカルボニルオキシ基、イソペンチル  
 オキシカルボニルオキシ基、ベンジルオキシカルボニルオキシ基などが挙げられる。

#### 【0012】

一般式 (I) において、Xとしては $NR^3$ 、酸素原子、又は硫黄原子のいずれかであるが  
 、前記 $R^3$ は水素原子または炭素数 1～3のアルキル基で、当該アルキル基としては、メ  
 チル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基等である。

一般式 (I) Yにおける、窒素原子、酸素原子、または硫黄原子から選択される 1 もしく  
 は 2 個のヘテロ原子を含む 5 または 6 員単環芳香族ヘテロ環としては、チオフェン環、フ  
 ラン環、ピロール環、チアゾール環、イソオキサゾール環、オキサゾール環、ピラゾール  
 環、イミダゾール環、ピリジン環、ピラジン環、ピリミジン環、またはピリダジン環など  
 が挙げられ、窒素原子、酸素原子、または硫黄原子から選択される 1 もしくは 2 個のヘテ  
 ロ原子を含む縮合 2 環性芳香族ヘテロ環としては、ベンゾチオフェン環、ベンゾフラン環  
 、インドール環、ベンゾチアゾール環、ベンゾオキサゾール環、ベンゾイミダゾール環、  
 キノリン環、イソキノリン環などが挙げられる。上記の Y は、非置換でも、また置換基に  
 よってその一部が置換されていてもよい。好ましい Y としては、ナフタレン環、チオフェ  
 ン環、ピリジン環及びピラジン環が挙げられ、これらの環は非置換でも、また置換基によ  
 ってその一部が置換されていてもよい。例えば当該 Y がピリジン環である場合は 1～4 個  
 の置換基によってピリジン環の任意の位置に置換されていてもよく、当該 Y がピラジン環  
 である場合は 1～3 個の置換基によってピラジン環の任意の位置に置換されていてもよい  
 。また、当該 Y が 2 個以上の置換基によって置換されている場合は、それぞれの置換基は  
 互いに同一でも異なってもよい。

10

20

30

40

50

このYの置換基としては炭素数1～4のアルキル基、炭素数1～4のアルコキシ基、水酸基、メルカプト基、炭素数1～4のアルキルチオ基、ハロゲン原子、アミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数1～4のモノアルキルアミノ基、1-ピロリジニル、2-ピロリジニル基、3-ピロリジニル基、ピペリジノ基、モルホリノ基、3-モルホリニル基等が挙げられる。前記炭素数1～4のアルキル基及び炭素数1～4のアルコキシ基、さらには前記炭素数2～8のジアルキルアミノ基及び炭素数1～4のモノアルキルアミノ基中のアルキル基は、先に述べたR<sup>1</sup>の場合と同様である。前記炭素数1～4のアルキルチオ基としては、メチルチオ基、エチルチオ基、1-プロピルチオ基、2-プロピルチオ基、1-ブチルチオ基、2-ブチルチオ基、t-ブチルチオ基などが挙げられる。前記ハロゲン原子としては、フッ素、塩素、臭素が挙げられる。

# 【0013】

置換基を有するYとしては、2-メチル-1-ナフチル基、3-メチル-1-ナフチル基、4-メチル-1-ナフチル基、5-メチル-1-ナフチル基、6-メチル-1-ナフチル基、7-メチル-1-ナフチル基、8-メチル-1-ナフチル基、1-メチル-2-ナフチル基、3-メチル-2-ナフチル基、4-メチル-2-ナフチル基、5-メチル-2-ナフチル基、6-メチル-2-ナフチル基、7-メチル-2-ナフチル基、8-メチル-2-ナフチル基、2-メトキシ-1-ナフチル基、3-メトキシ-1-ナフチル基、4-メトキシ-1-ナフチル基、5-メトキシ-1-ナフチル基、6-メトキシ-1-ナフチル基、7-メトキシ-1-ナフチル基、8-メトキシ-1-ナフチル基、1-メトキシ-2-ナフチル基、3-メトキシ-2-ナフチル基、4-メトキシ-2-ナフチル基、5-メトキシ-2-ナフチル基、6-メトキシ-2-ナフチル基、7-メトキシ-2-ナフチル基、8-メトキシ-2-ナフチル基、2-エトキシ-1-ナフチル基、3-エトキシ-1-ナフチル基、4-エトキシ-1-ナフチル基、5-エトキシ-1-ナフチル基、6-エトキシ-1-ナフチル基、7-エトキシ-1-ナフチル基、8-エトキシ-1-ナフチル基、1-エトキシ-2-ナフチル基、3-エトキシ-2-ナフチル基、4-エトキシ-2-ナフチル基、5-エトキシ-2-ナフチル基、6-エトキシ-2-ナフチル基、7-エトキシ-2-ナフチル基、8-エトキシ-2-ナフチル基、2-ヒドロキシ-1-ナフチル基、3-ヒドロキシ-1-ナフチル基、4-ヒドロキシ-1-ナフチル基、5-ヒドロキシ-1-ナフチル基、6-ヒドロキシ-1-ナフチル基、7-ヒドロキシ-1-ナフチル基、8-ヒドロキシ-1-ナフチル基、1-ヒドロキシ-2-ナフチル基、3-ヒドロキシ-2-ナフチル基、4-ヒドロキシ-2-ナフチル基、5-ヒドロキシ-2-ナフチル基、6-ヒドロキシ-2-ナフチル基、7-ヒドロキシ-2-ナフチル基、8-ヒドロキシ-2-ナフチル基、2-クロロ-1-ナフチル基、3-クロロ-1-ナフチル基、4-クロロ-1-ナフチル基、5-クロロ-1-ナフチル基、6-クロロ-1-ナフチル基、7-クロロ-1-ナフチル基、8-クロロ-1-ナフチル基、1-クロロ-2-ナフチル基、3-クロロ-2-ナフチル基、4-クロロ-2-ナフチル基、5-クロロ-2-ナフチル基、6-クロロ-2-ナフチル基、7-クロロ-2-ナフチル基、8-クロロ-2-ナフチル基、2-フルオロ-1-ナフチル基、3-フルオロ-1-ナフチル基、4-フルオロ-1-ナフチル基、5-フルオロ-1-ナフチル基、6-フルオロ-1-ナフチル基、7-フルオロ-1-ナフチル基、8-フルオロ-1-ナフチル基、1-フルオロ-2-ナフチル基、3-フルオロ-2-ナフチル基、4-フルオロ-2-ナフチル基、5-フルオロ-2-ナフチル基、6-フルオロ-2-ナフチル基、7-フルオロ-2-ナフチル基、8-フルオロ-2-ナフチル基、2-アミノ-1-ナフチル基、3-アミノ-1-ナフチル基、4-アミノ-1-ナフチル基、5-アミノ-1-ナフチル基、6-アミノ-1-ナフチル基、7-アミノ-1-ナフチル基、8-アミノ-1-ナフチル基、1-アミノ-2-ナフチル基、3-アミノ-2-ナフチル基、4-アミノ-2-ナフチル基、5-アミノ-2-ナフチル基、6-アミノ-2-ナフチル基、7-アミノ-2-ナフチル基、8-アミノ-2-ナフチル基、2-メチルアミノ-1-ナフチル基、3-メチルアミノ-1-ナフチル基、4-メチルアミノ-1-ナフチル基、5-メチルアミノ-1-ナフチル基、6-メチルアミノ-1-ナフチル基、7-メチルアミノ-1-ナフチル基、8-メ

10

20

30

40

50

チルアミノ-1-ナフチル基、1-メチルアミノ-2-ナフチル基、3-メチルアミノ-  
 2-ナフチル基、4-メチルアミノ-2-ナフチル基、5-メチルアミノ-2-ナフチル  
 基、6-メチルアミノ-2-ナフチル基、7-メチルアミノ-2-ナフチル基、8-メチ  
 ルアミノ-2-ナフチル基、2-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、3-ジメチルアミノ  
 -1-ナフチル基、4-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、5-ジメチルアミノ-1-ナ  
 フチル基、6-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、7-ジメチルアミノ-1-ナフチル基  
 、8-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、1-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、3-ジ  
 メチルアミノ-2-ナフチル基、4-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、5-ジメチルア  
 ミノ-2-ナフチル基、6-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、7-ジメチルアミノ-2  
 -ナフチル基、8-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、3-メチル-2-チエニル基、4  
 -メチル-2-チエニル基、5-メチル-2-チエニル基、2-メチル-3-チエニル基  
 、4-メチル-3-チエニル基、5-メチル-3-チエニル基、3-メトキシ-2-チエ  
 ニル基、4-メトキシ-2-チエニル基、5-メトキシ-2-チエニル基、2-メトキシ  
 -3-チエニル基、4-メトキシ-3-チエニル基、5-メトキシ-3-チエニル基、3  
 -クロロ-2-チエニル基、4-クロロ-2-チエニル基、5-クロロ-2-チエニル基  
 、2-クロロ-3-チエニル基、4-クロロ-3-チエニル基、5-クロロ-3-チエニ  
 ル基、3-フルオロ-2-チエニル基、4-フルオロ-2-チエニル基、5-フルオロ-  
 2-チエニル基、2-フルオロ-3-チエニル基、4-フルオロ-3-チエニル基、5-  
 フルオロ-3-チエニル基、3-メチル-2-フリル基、4-メチル-2-フリル基、5  
 -メチル-2-フリル基、2-メチル-3-フリル基、4-メチル-3-フリル基、5-  
 メチル-3-フリル基、3-メトキシ-2-フリル基、4-メトキシ-2-フリル基、5  
 -メトキシ-2-フリル基、2-メトキシ-3-フリル基、4-メトキシ-3-フリル基  
 、5-メトキシ-3-フリル基、3-クロロ-2-フリル基、4-クロロ-2-フリル基  
 、5-クロロ-2-フリル基、2-クロロ-3-フリル基、4-クロロ-3-フリル基、  
 5-クロロ-3-フリル基、3-フルオロ-2-フリル基、4-フルオロ-2-フリル基  
 、5-フルオロ-2-フリル基、2-フルオロ-3-フリル基、4-フルオロ-3-フリ  
 ル基、5-フルオロ-3-フリル基、3-メチル-2-ピロリル基、4-メチル-2-ピ  
 ロリル基、5-メチル-2-ピロリル基、2-メチル-3-ピロリル基、4-メチル-3  
 -ピロリル基、5-メチル-3-ピロリル基、3-メトキシ-2-ピロリル基、4-メト  
 キシ-2-ピロリル基、5-メトキシ-2-ピロリル基、2-メトキシ-3-ピロリル基  
 、4-メトキシ-3-ピロリル基、5-メトキシ-3-ピロリル基、3-クロロ-2-ピ  
 ロリル基、4-クロロ-2-ピロリル基、5-クロロ-2-ピロリル基、2-クロロ-3  
 -ピロリル基、4-クロロ-3-ピロリル基、5-クロロ-3-ピロリル基、3-フルオ  
 ロ-2-ピロリル基、4-フルオロ-2-ピロリル基、5-フルオロ-2-ピロリル基、  
 2-フルオロ-3-ピロリル基、4-フルオロ-3-ピロリル基、5-フルオロ-3-ピ  
 ロリル基、1-メチル-2-イミダゾリル基、4-メチル-2-イミダゾリル基、1-メ  
 チル-4-イミダゾリル基、2-メチル-4-イミダゾリル基、5-メチル-4-イミダ  
 ズリル基、1-メチル-5-イミダゾリル基、4-メトキシ-2-イミダゾリル基、2-  
 メトキシ-4-イミダゾリル基、5-メトキシ-4-イミダゾリル基、4-クロロ-2-  
 イミダゾリル基、2-クロロ-4-イミダゾリル基、5-クロロ-4-イミダゾリル基、  
 4-フルオロ-2-イミダゾリル基、2-フルオロ-4-イミダゾリル基、5-フルオロ  
 -4-イミダゾリル基、2-メチル-3-ピリジル基、4-メチル-3-ピリジル基、5  
 -メチル-3-ピリジル基、6-メチル-3-ピリジル基、3-メチル-2-ピリジル基  
 、4-メチル-2-ピリジル基、5-メチル-2-ピリジル基、6-メチル-2-ピリジ  
 ル基、2-メチル-4-ピリジル基、3-メチル-4-ピリジル基、5-メチル-4-ピ  
 リジル基、6-メチル-4-ピリジル基、2-エチル-3-ピリジル基、4-エチル-3  
 -ピリジル基、5-エチル-3-ピリジル基、6-エチル-3-ピリジル基、3-メチル  
 -2-ピリジル基、4-メチル-2-ピリジル基、5-メチル-2-ピリジル基、6-エ  
 チル-2-ピリジル基、2-エチル-4-ピリジル基、3-エチル-4-ピリジル基、5  
 -エチル-4-ピリジル基、6-エチル-4-ピリジル基、2-メトキシ-3-ピリジル



[illegible]

ル基、6-ピペリジノ-3-ピリジル基、3-ピペリジノ-2-ピリジル基、4-ピペリ  
 ジノ-2-ピリジル基、5-ピペリジノ-2-ピリジル基、6-ピペリジノ-2-ピリジ  
 ル基、2-ピペリジノ-4-ピリジル基、3-ピペリジノ-4-ピリジル基、5-ピペリ  
 ジノ-4-ピリジル基、6-ピペリジノ-4-ピリジル基、2-モルホリノ-3-ピリジ  
 ル基、4-モルホリノ-3-ピリジル基、5-モルホリノ-3-ピリジル基、6-モルホ  
 リノ-3-ピリジル基、3-モルホリノ-2-ピリジル基、4-モルホリノ-2-ピリジ  
 ル基、5-モルホリノ-2-ピリジル基、6-モルホリノ-2-ピリジル基、2-モルホ  
 リノ-4-ピリジル基、3-モルホリノ-4-ピリジル基、5-モルホリノ-4-ピリジ  
 ル基、6-モルホリノ-4-ピリジル基、2-フルオロ-3-ピリジル基、4-フルオロ  
 -3-ピリジル基、5-フルオロ-3-ピリジル基、6-フルオロ-3-ピリジル基、3  
 -フルオロ-2-ピリジル基、4-フルオロ-2-ピリジル基、5-フルオロ-2-ピリ  
 ジル基、6-フルオロ-2-ピリジル基、2-フルオロ-4-ピリジル基、3-フルオロ  
 -4-ピリジル基、5-フルオロ-4-ピリジル基、6-フルオロ-4-ピリジル基、2  
 , 4-ジメチル-3-ピリジル基、2, 6-ジメチル-3-ピリジル基、5, 6-ジメチ  
 ル-3-ピリジル基、4, 6-ジメチル-3-ピリジル基、4, 5-ジメチル-2-ピリ  
 ジル基、5, 6-ジメチル-2-ピリジル基、2, 3-ジメチル-4-ピリジル基、2,  
 6-ジメチル-4-ピリジル基、2, 4-ジメトキシ-3-ピリジル基、2, 6-ジメト  
 キシ-3-ピリジル基、5, 6-ジメトキシ-3-ピリジル基、4, 6-ジメトキシ-3  
 -ピリジル基、4, 5-ジメトキシ-2-ピリジル基、5, 6-ジメトキシ-2-ピリジ  
 ル基、2, 3-ジメトキシ-4-ピリジル基、2, 6-ジメトキシ-4-ピリジル基、2  
 -クロロ-6-メチル-3-ピリジル基、6-クロロ-2-メチル-3-ピリジル、2-  
 クロロ-6-メトキシ-3-ピリジル基、6-クロロ-2-メトキシ-3-ピリジル基、  
 5-メチル-6-クロロ-3-ピリジル基、5-メトキシ-6-クロロ-3-ピリジル基  
 、5-エトキシ-6-クロロ-3-ピリジル基、5-クロロ-6-メチル-3-ピリジル  
 基、5-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル基、5-エトキシ-6-メチル-3-ピリ  
 ジル基、5-クロロ-6-メトキシ-3-ピリジル基、5-クロロ-6-エトキシ-3-  
 ピリジル基、2, 5, 6-トリメチル-3-ピリジル基、2-ピラジニル基、5-メチル  
 -2-ピラジニル基、6-メチル-2-ピラジニル基、5-メトキシ-2-ピラジニル基  
 、6-メトキシ-2-ピラジニル基、5-エトキシ-2-ピラジニル基、6-エトキシ-  
 2-ピラジニル基、5-クロロ-2-ピラジニル基、6-クロロ-2-ピラジニル基、3  
 -メチル-2-ベンゾチエニル基、4-メチル-2-ベンゾチエニル基、5-メチル-2  
 -ベンゾチエニル基、6-メチル-2-ベンゾチエニル基、7-メチル-2-ベンゾチエ  
 ニル基、2-メチル-3-ベンゾチエニル基、4-メチル-3-ベンゾチエニル基、5-  
 メチル-3-ベンゾチエニル基、6-メチル-3-ベンゾチエニル基、7-メチル-3-  
 ベンゾチエニル基、2-メチル-5-ベンゾチエニル基、3-メチル-5-ベンゾチエ  
 ニル基、4-メチル-5-ベンゾチエニル基、6-メチル-5-ベンゾチエニル基、7-メ  
 チル-5-ベンゾチエニル基、3-メトキシ-2-ベンゾチエニル基、4-メトキシ-2  
 -ベンゾチエニル基、5-メトキシ-2-ベンゾチエニル基、6-メトキシ-2-ベンゾ  
 チエニル基、7-メトキシ-2-ベンゾチエニル基、2-メトキシ-3-ベンゾチエニル  
 基、4-メトキシ-3-ベンゾチエニル基、5-メトキシ-3-ベンゾチエニル基、6-  
 メトキシ-3-ベンゾチエニル基、7-メトキシ-3-ベンゾチエニル基、2-メトキシ  
 -5-ベンゾチエニル基、3-メトキシ-5-ベンゾチエニル基、4-メトキシ-5-ベ  
 ンゾチエニル基、6-メトキシ-5-ベンゾチエニル基、7-メトキシ-5-ベンゾチエ  
 ニル基、3-クロロ-2-ベンゾチエニル基、4-クロロ-2-ベンゾチエニル基、5-  
 クロロ-2-ベンゾチエニル基、6-クロロ-2-ベンゾチエニル基、7-クロロ-2-  
 ベンゾチエニル基、2-クロロ-3-ベンゾチエニル基、4-クロロ-3-ベンゾチエニ  
 ル基、5-クロロ-3-ベンゾチエニル基、6-クロロ-3-ベンゾチエニル基、7-ク  
 ロロ-3-ベンゾチエニル基、2-クロロ-5-ベンゾチエニル基、3-クロロ-5-ベ  
 ンゾチエニル基、4-クロロ-5-ベンゾチエニル基、6-クロロ-5-ベンゾチエニル  
 基、7-クロロ-5-ベンゾチエニル基、3-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、4-フ

10

20

30

40

50

ルオロ-2-ベンゾチエニル基、5-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、6-フルオロ-  
 2-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、2-フルオロ-3-ベン  
 ゾチエニル基、4-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、5-フルオロ-3-ベンゾチエニ  
 ル基、6-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、2  
 -フルオロ-5-ベンゾチエニル基、3-フルオロ-5-ベンゾチエニル基、4-フルオ  
 ロ-5-ベンゾチエニル基、6-フルオロ-5-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-5-  
 ベンゾチエニル基、3-メチル-2-ベンゾフリル基、4-メチル-2-ベンゾフリル基  
 、5-メチル-2-ベンゾフリル基、6-メチル-2-ベンゾフリル基、7-メチル-2  
 -ベンゾフリル基、2-メチル-3-ベンゾフリル基、4-メチル-3-ベンゾフリル基  
 、5-メチル-3-ベンゾフリル基、6-メチル-3-ベンゾフリル基、7-メチル-3  
 -ベンゾフリル基、2-メチル-5-ベンゾフリル基、3-メチル-5-ベンゾフリル基  
 、4-メチル-5-ベンゾフリル基、6-メチル-5-ベンゾフリル基、7-メチル-5  
 -ベンゾフリル基、3-メトキシ-2-ベンゾフリル基、4-メトキシ-2-ベンゾフリ  
 ル基、5-メトキシ-2-ベンゾフリル基、6-メトキシ-2-ベンゾフリル基、7-メ  
 トキシ-2-ベンゾフリル基、2-メトキシ-3-ベンゾフリル基、4-メトキシ-3-  
 ベンゾフリル基、5-メトキシ-3-ベンゾフリル基、6-メトキシ-3-ベンゾフリ  
 ル基、7-メトキシ-3-ベンゾフリル基、2-メトキシ-5-ベンゾフリル基、3-メト  
 キシ-5-ベンゾフリル基、4-メトキシ-5-ベンゾフリル基、6-メトキシ-5-ベ  
 ンゾフリル基、7-メトキシ-5-ベンゾフリル基、3-クロロ-2-ベンゾフリル基、  
 4-クロロ-2-ベンゾフリル基、5-クロロ-2-ベンゾフリル基、6-クロロ-2-  
 ベンゾフリル基、7-クロロ-2-ベンゾフリル基、2-クロロ-3-ベンゾフリル基、  
 4-クロロ-3-ベンゾフリル基、5-クロロ-3-ベンゾフリル基、6-クロロ-3-  
 ベンゾフリル基、7-クロロ-3-ベンゾフリル基、2-クロロ-5-ベンゾフリル基、  
 3-クロロ-5-ベンゾフリル基、4-クロロ-5-ベンゾフリル基、6-クロロ-5-  
 ベンゾフリル基、7-クロロ-5-ベンゾフリル基、3-フルオロ-2-ベンゾフリル基  
 、4-フルオロ-2-ベンゾフリル基、5-フルオロ-2-ベンゾフリル基、6-フルオ  
 ロ-2-ベンゾフリル基、7-フルオロ-2-ベンゾフリル基、2-フルオロ-3-ベン  
 ゾフリル基、4-フルオロ-3-ベンゾフリル基、5-フルオロ-3-ベンゾフリル基、  
 6-フルオロ-3-ベンゾフリル基、7-フルオロ-3-ベンゾフリル基、2-フルオロ  
 -5-ベンゾフリル基、3-フルオロ-5-ベンゾフリル基、4-フルオロ-5-ベンゾ  
 フリル基、6-フルオロ-5-ベンゾフリル基、7-フルオロ-5-ベンゾフリル基、1  
 -メチル-2-インドリル基、3-メチル-2-インドリル基、4-メチル-2-インド  
 リル基、5-メチル-2-インドリル基、6-メチル-2-インドリル基、7-メチル-  
 2-インドリル基、1-メチル-3-インドリル基、2-メチル-3-インドリル基、4  
 -メチル-3-インドリル基、5-メチル-3-インドリル基、6-メチル-3-インド  
 リル基、7-メチル-3-インドリル基、1-メチル-5-インドリル基、2-メチル-  
 5-インドリル基、3-メチル-5-インドリル基、4-メチル-5-インドリル基、6  
 -メチル-5-インドリル基、7-メチル-5-インドリル基、3-メトキシ-2-イン  
 ドリル基、4-メトキシ-2-インドリル基、5-メトキシ-2-インドリル基、6-メ  
 トキシ-2-インドリル基、7-メトキシ-2-インドリル基、2-メトキシ-3-イン  
 ドリル基、4-メトキシ-3-インドリル基、5-メトキシ-3-インドリル基、6-メ  
 トキシ-3-インドリル基、7-メトキシ-3-インドリル基、2-メトキシ-5-イン  
 ドリル基、3-メトキシ-5-インドリル基、4-メトキシ-5-インドリル基、6-メ  
 トキシ-5-インドリル基、7-メトキシ-5-インドリル基、3-クロロ-2-インド  
 リル基、4-クロロ-2-インドリル基、5-クロロ-2-インドリル基、6-クロロ-  
 2-インドリル基、7-クロロ-2-インドリル基、2-クロロ-3-インドリル基、4  
 -クロロ-3-インドリル基、5-クロロ-3-インドリル基、6-クロロ-3-インド  
 リル基、7-クロロ-3-インドリル基、2-クロロ-5-インドリル基、3-クロロ-  
 5-インドリル基、4-クロロ-5-インドリル基、6-クロロ-5-インドリル基、7  
 -クロロ-5-インドリル基、3-フルオロ-2-インドリル基、4-フルオロ-2-イ

10

20

30

40

50

ンドリル基、5-フルオロ-2-インドリル基、6-フルオロ-2-インドリル基、7-フルオロ-2-インドリル基、2-フルオロ-3-インドリル基、4-フルオロ-3-インドリル基、5-フルオロ-3-インドリル基、6-フルオロ-3-インドリル基、7-フルオロ-3-インドリル基、2-フルオロ-5-インドリル基、3-フルオロ-5-インドリル基、4-フルオロ-5-インドリル基、6-フルオロ-5-インドリル基、7-フルオロ-5-インドリル基、3-メチル-2-キノリル基、4-メチル-2-キノリル基、5-メチル-2-キノリル基、6-メチル-2-キノリル基、7-メチル-2-キノリル基、8-メチル-2-キノリル基、2-メチル-4-キノリル基、3-メチル-4-キノリル基、5-メチル-4-キノリル基、6-メチル-4-キノリル基、7-メチル-4-キノリル基、8-メチル-4-キノリル基、2-メチル-6-キノリル基、3-メチル-6-キノリル基、4-メチル-6-キノリル基、5-メチル-6-キノリル基、7-メチル-6-キノリル基、8-メチル-6-キノリル基、3-メトキシ-2-キノリル基、4-メトキシ-2-キノリル基、5-メトキシ-2-キノリル基、6-メトキシ-2-キノリル基、7-メトキシ-2-キノリル基、8-メトキシ-2-キノリル基、2-メトキシ-4-キノリル基、3-メトキシ-4-キノリル基、5-メトキシ-4-キノリル基、6-メトキシ-4-キノリル基、7-メトキシ-4-キノリル基、8-メトキシ-4-キノリル基、2-メトキシ-6-キノリル基、3-メトキシ-6-キノリル基、4-メトキシ-6-キノリル基、5-メトキシ-6-キノリル基、7-メトキシ-6-キノリル基、8-メトキシ-6-キノリル基、3-クロロ-2-キノリル基、4-クロロ-2-キノリル基、5-クロロ-2-キノリル基、6-クロロ-2-キノリル基、7-クロロ-2-キノリル基、8-クロロ-2-キノリル基、2-クロロ-4-キノリル基、3-クロロ-4-キノリル基、5-クロロ-4-キノリル基、6-クロロ-4-キノリル基、7-クロロ-4-キノリル基、8-クロロ-4-キノリル基、2-クロロ-6-キノリル基、3-クロロ-6-キノリル基、4-クロロ-6-キノリル基、5-クロロ-6-キノリル基、7-クロロ-6-キノリル基、8-クロロ-6-キノリル基、3-フルオロ-2-キノリル基、4-フルオロ-2-キノリル基、5-フルオロ-2-キノリル基、6-フルオロ-2-キノリル基、7-フルオロ-2-キノリル基、8-フルオロ-2-キノリル基、2-フルオロ-4-キノリル基、3-フルオロ-4-キノリル基、5-フルオロ-4-キノリル基、6-フルオロ-4-キノリル基、7-フルオロ-4-キノリル基、8-フルオロ-4-キノリル基、2-フルオロ-6-キノリル基、3-フルオロ-6-キノリル基、4-フルオロ-6-キノリル基、5-フルオロ-6-キノリル基、7-フルオロ-6-キノリル基、8-フルオロ-6-キノリル基などが挙げられる。

#### 【0014】

前記一般式(1)において、さらに好ましいXとしてはNHまたは酸素原子が挙げられる。特にはNHが好ましい。

前記一般式(1)においてさらに好ましいR<sup>1</sup>としては炭素数1~6個のアルキル基、炭素数2~6個のアルケニル基、炭素数2~6個のアルキニル基が挙げられ、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、2-ブチル基、ペンチル基、2-ペンチル基、ヘキシル基、2-ヘキシル基、ビニル基、プロペニル基、ブテニル基、ブチニル基、ペンテニル基などが挙げられる。中でも炭素数3~5個のアルキル基、炭素数3~5個のアルケニル基、炭素数3~5個のアルキニル基、具体的にはプロピル基、イソプロピル基、ブチル基、2-ブチル基、ペンチル基、2-ペンチル基、プロペニル基、ブテニル基、ブチニル基、ペンテニル基などが更に好ましく、特にはプロピル基、ブチル基、ペンチル基が好ましい。

前記一般式(1)においてさらに好ましいR<sup>2</sup>としては例えば水酸基、アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、プロポキシカルボニルオキシ基、ブトキシカルボニルオキシ基などが挙げられ、特には水酸基、メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基が好ましい。

前記一般式(1)においてさらに好ましいYとしては、それぞれ置換もしくは非置換の、ピリジン環(2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル)及びピラジン環(2-ピラジ

ニル、3-ピラジニル)が挙げられ、特に3-ピリジル基が好ましい。さらに好ましい置換基を有したYとしては、例えば、2-メチル-3-ピリジル基、6-メチル-3-ピリジル基、2-エチル-3-ピリジル基、6-エチル-3-ピリジル基、2-メトキシ-3-ピリジル基、6-メトキシ-3-ピリジル基、2-エトキシ-3-ピリジル基、6-エトキシ-3-ピリジル基、2-クロロ-3-ピリジル基、6-クロロ-3-ピリジル基、6-ジメチルアミノ-3-ピリジル基、6-(1-ピロリジニル)-3-ピリジル基、6-ピペリジノ-3-ピリジル基、6-モルホリノ-3-ピリジル基、6-メチルチオ-3-ピリジル基、5, 6-ジメチル-3-ピリジル基、5, 6-ジメトキシ-3-ピリジル基、2, 6-ジクロロ-3-ピリジル基、5, 6-ジクロロ-3-ピリジル基、5-クロロ-6-メトキシ-3-ピリジル基などが好ましく、中でも特に3-ピリジル基、6-メチル-3-ピリジル基、6-メトキシ-3-ピリジル基、6-エトキシ-3-ピリジル基、6-クロロ-3-ピリジル基、6-(1-ピロリジニル)-3-ピリジル基、6-モルホリノ-3-ピリジル基、2-メチル-3-ピリジル基、2-メトキシ-3-ピリジル基、2-クロロ-3-ピリジル基が好ましい。

本発明に具体的に含まれる化合物としては、例えば以下の化合物が挙げられる。

【0015】

【表1】

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	propyl	OH	2-pyridyl
NH	propyl	OH	3-pyridyl
NH	propyl	OH	4-pyridyl
NH	propyl	OH	2-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OH	4-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2-ethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OH	4-ethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5-ethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OH	6-ethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2-methoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	4-methoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5-methoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	6-methoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2-ethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	4-ethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5-ethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	6-ethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2-chloro-3-pyridyl
NH	propyl	OH	4-chloro-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5-chloro-3-pyridyl
NH	propyl	OH	6-chloro-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2-fluoro-3-pyridyl
NH	propyl	OH	4-fluoro-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5-fluoro-3-pyridyl
NH	propyl	OH	6-fluoro-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2-dimethylamino-3-pyridyl
NH	propyl	OH	4-dimethylamino-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5-dimethylamino-3-pyridyl
NH	propyl	OH	6-dimethylamino-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	propyl	OH	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	propyl	OH	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2-piperidino-3-pyridyl
NH	propyl	OH	4-piperidino-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5-piperidino-3-pyridyl
NH	propyl	OH	6-piperidino-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2-morpholino-3-pyridyl
NH	propyl	OH	4-morpholino-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5-morpholino-3-pyridyl
NH	propyl	OH	6-morpholino-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2-hydroxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	4-hydroxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5-hydroxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

NH	propyl	OH	2-mercapto-3-pyridyl
NH	propyl	OH	4-mercapto-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5-mercapto-3-pyridyl
NH	propyl	OH	6-mercapto-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2-methylthio-3-pyridyl
NH	propyl	OH	4-methylthio-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5-methylthio-3-pyridyl
NH	propyl	OH	6-methylthio-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2,6-diethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5,6-diethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2,6-dichloro-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5,6-dichloro-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OH	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OH	2-methyl-4-pyridyl
NH	propyl	OH	2-ethyl-4-pyridyl
NH	propyl	OH	2-methoxy-4-pyridyl
NH	propyl	OH	2-ethoxy-4-pyridyl
NH	propyl	OH	2-chloro-4-pyridyl
NH	propyl	OH	2-dimethylamino-4-pyridyl
NH	propyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
NH	propyl	OH	2-piperidino-4-pyridyl
NH	propyl	OH	2-morpholino-4-pyridyl
NH	propyl	OH	2-methylthio-4-pyridyl
NH	propyl	OH	2-pyrazinyl
NH	propyl	OH	5-methyl-2-pyrazinyl
NH	propyl	OH	5-ethyl-2-pyrazinyl
NH	propyl	OH	5-methoxy-2-pyrazinyl
NH	propyl	OH	5-ethoxy-2-pyrazinyl
NH	propyl	OH	5-chloro-2-pyrazinyl
NH	propyl	OH	6-methyl-2-pyrazinyl
NH	propyl	OH	6-methoxy-2-pyrazinyl
NH	propyl	OH	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	propyl	OCOOMe	2-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	4-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	4-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	6-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-ethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	4-ethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5-ethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	6-ethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-methoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	4-methoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5-methoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	6-methoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-ethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	4-ethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5-ethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	6-ethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-chloro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	4-chloro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5-chloro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	6-chloro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-fluoro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	4-fluoro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5-fluoro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	6-fluoro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-dimethylamino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	4-dimethylamino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5-dimethylamino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	6-dimethylamino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-piperidino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	4-piperidino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5-piperidino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	6-piperidino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-morpholino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	4-morpholino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5-morpholino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	6-morpholino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-hydroxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	4-hydroxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5-hydroxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40



NH	propyl	OCOOMe	2-mercapto-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	4-mercapto-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5-mercapto-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	6-mercapto-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-methylthio-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	4-methylthio-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5-methylthio-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	6-methylthio-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2,6-diethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5,6-diethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2,6-dichloro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5,6-dichloro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-methyl-4-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-ethyl-4-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-methoxy-4-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-ethoxy-4-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-chloro-4-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-dimethylamino-4-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-piperidino-4-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-morpholino-4-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-methylthio-4-pyridyl
NH	propyl	OCOOMe	2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOOMe	5-methyl-2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOOMe	5-ethyl-2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOOMe	5-methoxy-2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOOMe	5-ethoxy-2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOOMe	5-chloro-2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOOMe	6-methyl-2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOOMe	6-methoxy-2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOOMe	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	propyl	OCOEt	2-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	4-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	4-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	6-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-ethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	4-ethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5-ethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	6-ethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-methoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	4-methoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5-methoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	6-methoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-ethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	4-ethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5-ethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	6-ethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-chloro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	4-chloro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5-chloro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	6-chloro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-fluoro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	4-fluoro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5-fluoro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	6-fluoro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-dimethylamino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	4-dimethylamino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5-dimethylamino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	6-dimethylamino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-piperidino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	4-piperidino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5-piperidino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	6-piperidino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-morpholino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	4-morpholino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5-morpholino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	6-morpholino-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-hydroxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	4-hydroxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5-hydroxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

NH	propyl	OCOEt	2-mercapto-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	4-mercapto-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5-mercapto-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	6-mercapto-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-methylthio-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	4-methylthio-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5-methylthio-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	6-methylthio-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2,6-diethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5,6-diethyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2,6-dichloro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5,6-dichloro-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-methyl-4-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-ethyl-4-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-methoxy-4-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-ethoxy-4-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-chloro-4-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-dimethylamino-4-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-piperidino-4-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-morpholino-4-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-methylthio-4-pyridyl
NH	propyl	OCOEt	2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOEt	5-methyl-2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOEt	5-ethyl-2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOEt	5-methoxy-2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOEt	5-ethoxy-2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOEt	5-chloro-2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOEt	6-methyl-2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOEt	6-methoxy-2-pyrazinyl
NH	propyl	OCOEt	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	n-butyl	OH	2-pyridyl
NH	n-butyl	OH	3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	4-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	4-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-ethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	4-ethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5-ethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	6-ethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-methoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	4-methoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5-methoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	6-methoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	4-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	6-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-chloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	4-chloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5-chloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	6-chloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-fluoro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	4-fluoro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5-fluoro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	6-fluoro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	4-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	6-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-piperidino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	4-piperidino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5-piperidino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	6-piperidino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-morpholino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	4-morpholino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5-morpholino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	6-morpholino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	4-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

NH	n-butyl	OH	2-mercapto-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	4-mercapto-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5-mercapto-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	6-mercapto-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-methylthio-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	4-methylthio-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5-methylthio-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	6-methylthio-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2,6-diethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5,6-diethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2,6-dichloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5,6-dichloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-methyl-4-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-ethyl-4-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-methoxy-4-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-ethoxy-4-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-chloro-4-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-dimethylamino-4-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-piperidino-4-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-morpholino-4-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-methylthio-4-pyridyl
NH	n-butyl	OH	2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OH	5-methyl-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OH	5-ethyl-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OH	5-methoxy-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OH	5-ethoxy-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OH	5-chloro-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OH	6-methyl-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OH	6-methoxy-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OH	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	n-butyl	OCOOMe	2-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-ethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-ethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-ethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-ethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-methoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-methoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-methoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-methoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-chloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-chloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-chloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-chloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-fluoro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-fluoro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-fluoro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-fluoro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-piperidino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-piperidino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-piperidino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-piperidino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-morpholino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-morpholino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-morpholino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-morpholino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

NH	n-butyl	OCOOMe	2-mercapto-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-mercapto-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-mercapto-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-mercapto-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-methylthio-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-methylthio-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-methylthio-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-methylthio-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2,6-diethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5,6-diethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2,6-dichloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5,6-dichloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-methyl-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-ethyl-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-methoxy-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-ethoxy-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-chloro-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-dimethylamino-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-piperidino-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-morpholino-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-methylthio-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-methyl-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-ethyl-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-methoxy-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-ethoxy-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-chloro-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-methyl-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-methoxy-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	n-butyl	OCOEt	2-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	2-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	4-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	5-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	6-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	2-ethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	4-ethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	5-ethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	6-ethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	2-methoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	4-methoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	5-methoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	6-methoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	2-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	4-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	5-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	6-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	2-chloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	4-chloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	5-chloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	6-chloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	2-fluoro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	4-fluoro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	5-fluoro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	6-fluoro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	2-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	4-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	5-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	6-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	2-piperidino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	4-piperidino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	5-piperidino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	6-piperidino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	2-morpholino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	4-morpholino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	5-morpholino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	6-morpholino-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	2-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	4-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	5-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOEt	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40



NH	n-butyl	OCOOEt	2-mercapto-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	4-mercapto-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-mercapto-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	6-mercapto-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-methylthio-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	4-methylthio-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-methylthio-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	6-methylthio-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2,6-diethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5,6-diethyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2,6-dichloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5,6-dichloro-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-methyl-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-ethyl-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-methoxy-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-ethoxy-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-chloro-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-dimethylamino-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-piperidino-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-morpholino-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-methylthio-4-pyridyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-methyl-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-ethyl-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-methoxy-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-ethoxy-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-chloro-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOEt	6-methyl-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOEt	6-methoxy-2-pyrazinyl
NH	n-butyl	OCOOEt	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	n-pentyl	OH	2-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	4-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	4-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-ethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	4-ethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5-ethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	6-ethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-methoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	4-methoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5-methoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	6-methoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	4-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	6-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-chloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	4-chloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5-chloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	6-chloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-fluoro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	4-fluoro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5-fluoro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	6-fluoro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	4-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	6-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-piperidino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	4-piperidino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5-piperidino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	6-piperidino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-morpholino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	4-morpholino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5-morpholino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	6-morpholino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	4-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

NH	n-pentyl	OH	2-mercapto-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	4-mercapto-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5-mercapto-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	6-mercapto-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-methylthio-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	4-methylthio-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5-methylthio-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	6-methylthio-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2,6-diethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5,6-diethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2,6-dichloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5,6-dichloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-methyl-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-ethyl-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-methoxy-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-ethoxy-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-chloro-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-dimethylamino-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-piperidino-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-morpholino-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-methylthio-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OH	2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OH	5-methyl-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OH	5-ethyl-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OH	5-methoxy-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OH	5-ethoxy-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OH	5-chloro-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OH	6-methyl-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OH	6-methoxy-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OH	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-ethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-ethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-ethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-ethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-methoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-methoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-methoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-methoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-chloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-chloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-chloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-chloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-fluoro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-fluoro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-fluoro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-fluoro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-piperidino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-piperidino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-piperidino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-piperidino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-morpholino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-morpholino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-morpholino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-morpholino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

NH	n-pentyl	OCOOMe	2-mercapto-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-mercapto-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-mercapto-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-mercapto-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-methylthio-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-methylthio-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-methylthio-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-methylthio-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2,6-diethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5,6-diethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2,6-dichloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5,6-dichloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-methyl-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-ethyl-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-methoxy-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-ethoxy-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-chloro-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-dimethylamino-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-piperidino-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-morpholino-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-methylthio-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-methyl-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-ethyl-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-methoxy-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-ethoxy-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-chloro-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-methyl-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-methoxy-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	n-pentyl	OCOEt	2-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	6-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-ethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-ethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-ethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	6-ethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-methoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-methoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-methoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	6-methoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	6-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-chloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-chloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-chloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	6-chloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-fluoro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-fluoro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-fluoro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	6-fluoro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	6-dimethylamino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-piperidino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-piperidino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-piperidino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	6-piperidino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-morpholino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-morpholino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-morpholino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	6-morpholino-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-hydroxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOEt	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

NH	n-pentyl	OCOOEt	2-mercapto-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	4-mercapto-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	5-mercapto-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	6-mercapto-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2-methylthio-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	4-methylthio-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	5-methylthio-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	6-methylthio-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	5,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2,6-diethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	5,6-diethyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	5,6-diethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2,6-dichloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	5,6-dichloro-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2-methyl-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2-ethyl-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2-methoxy-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2-ethoxy-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2-chloro-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2-dimethylamino-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2-piperidino-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2-morpholino-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2-methylthio-4-pyridyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	5-methyl-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	5-ethyl-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	5-methoxy-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	5-ethoxy-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	5-chloro-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	6-methyl-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	6-methoxy-2-pyrazinyl
NH	n-pentyl	OCOOEt	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
O	propyl	OH	2-pyridyl
O	propyl	OH	3-pyridyl
O	propyl	OH	4-pyridyl
O	propyl	OH	2-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OH	4-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OH	5-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OH	2-ethyl-3-pyridyl
O	propyl	OH	4-ethyl-3-pyridyl
O	propyl	OH	5-ethyl-3-pyridyl
O	propyl	OH	6-ethyl-3-pyridyl
O	propyl	OH	2-methoxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	4-methoxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	5-methoxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	6-methoxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	2-ethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	4-ethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	5-ethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	6-ethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	2-chloro-3-pyridyl
O	propyl	OH	4-chloro-3-pyridyl
O	propyl	OH	5-chloro-3-pyridyl
O	propyl	OH	6-chloro-3-pyridyl
O	propyl	OH	2-fluoro-3-pyridyl
O	propyl	OH	4-fluoro-3-pyridyl
O	propyl	OH	5-fluoro-3-pyridyl
O	propyl	OH	6-fluoro-3-pyridyl
O	propyl	OH	2-dimethylamino-3-pyridyl
O	propyl	OH	4-dimethylamino-3-pyridyl
O	propyl	OH	5-dimethylamino-3-pyridyl
O	propyl	OH	6-dimethylamino-3-pyridyl
O	propyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	propyl	OH	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	propyl	OH	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	propyl	OH	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	propyl	OH	2-piperidino-3-pyridyl
O	propyl	OH	4-piperidino-3-pyridyl
O	propyl	OH	5-piperidino-3-pyridyl
O	propyl	OH	6-piperidino-3-pyridyl
O	propyl	OH	2-morpholino-3-pyridyl
O	propyl	OH	4-morpholino-3-pyridyl
O	propyl	OH	5-morpholino-3-pyridyl
O	propyl	OH	6-morpholino-3-pyridyl
O	propyl	OH	2-hydroxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	4-hydroxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	5-hydroxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40



O	propyl	OH	2-mercapto-3-pyridyl
O	propyl	OH	4-mercapto-3-pyridyl
O	propyl	OH	5-mercapto-3-pyridyl
O	propyl	OH	6-mercapto-3-pyridyl
O	propyl	OH	2-methylthio-3-pyridyl
O	propyl	OH	4-methylthio-3-pyridyl
O	propyl	OH	5-methylthio-3-pyridyl
O	propyl	OH	6-methylthio-3-pyridyl
O	propyl	OH	2,6-dimethyl-3-pyridyl
O	propyl	OH	5,6-dimethyl-3-pyridyl
O	propyl	OH	2,6-diethyl-3-pyridyl
O	propyl	OH	5,6-diethyl-3-pyridyl
O	propyl	OH	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	2,6-diethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	5,6-diethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	2,6-dichloro-3-pyridyl
O	propyl	OH	5,6-dichloro-3-pyridyl
O	propyl	OH	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OH	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OH	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OH	2-methyl-4-pyridyl
O	propyl	OH	2-ethyl-4-pyridyl
O	propyl	OH	2-methoxy-4-pyridyl
O	propyl	OH	2-ethoxy-4-pyridyl
O	propyl	OH	2-chloro-4-pyridyl
O	propyl	OH	2-dimethylamino-4-pyridyl
O	propyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
O	propyl	OH	2-piperidino-4-pyridyl
O	propyl	OH	2-morpholino-4-pyridyl
O	propyl	OH	2-methylthio-4-pyridyl
O	propyl	OH	2-pyrazinyl
O	propyl	OH	5-methyl-2-pyrazinyl
O	propyl	OH	5-ethyl-2-pyrazinyl
O	propyl	OH	5-methoxy-2-pyrazinyl
O	propyl	OH	5-ethoxy-2-pyrazinyl
O	propyl	OH	5-chloro-2-pyrazinyl
O	propyl	OH	6-methyl-2-pyrazinyl
O	propyl	OH	6-methoxy-2-pyrazinyl
O	propyl	OH	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
O	propyl	OCOOMe	2-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	4-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	4-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	6-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-ethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	4-ethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5-ethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	6-ethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-methoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	4-methoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5-methoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	6-methoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-ethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	4-ethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5-ethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	6-ethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-chloro-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	4-chloro-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5-chloro-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	6-chloro-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-fluoro-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	4-fluoro-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5-fluoro-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	6-fluoro-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-dimethylamino-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	4-dimethylamino-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5-dimethylamino-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	6-dimethylamino-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-piperidino-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	4-piperidino-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5-piperidino-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	6-piperidino-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-morpholino-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	4-morpholino-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5-morpholino-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	6-morpholino-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-hydroxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	4-hydroxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5-hydroxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

O	propyl	OCOOMe	2-mercapto-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	4-mercapto-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5-mercapto-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	6-mercapto-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-methylthio-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	4-methylthio-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5-methylthio-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	6-methylthio-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2,6-dimethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5,6-dimethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2,6-diethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5,6-diethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2,6-diethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5,6-diethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2,6-dichloro-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5,6-dichloro-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-methyl-4-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-ethyl-4-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-methoxy-4-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-ethoxy-4-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-chloro-4-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-dimethylamino-4-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-piperidino-4-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-morpholino-4-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-methylthio-4-pyridyl
O	propyl	OCOOMe	2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOMe	5-methyl-2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOMe	5-ethyl-2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOMe	5-methoxy-2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOMe	5-ethoxy-2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOMe	5-chloro-2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOMe	6-methyl-2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOMe	6-methoxy-2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOMe	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
O	propyl	OCOEt	2-pyridyl
O	propyl	OCOEt	3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	4-pyridyl
O	propyl	OCOEt	2-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	4-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	5-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	6-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	2-ethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	4-ethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	5-ethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	6-ethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	2-methoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	4-methoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	5-methoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	6-methoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	2-ethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	4-ethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	5-ethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	6-ethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	2-chloro-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	4-chloro-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	5-chloro-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	6-chloro-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	2-fluoro-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	4-fluoro-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	5-fluoro-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	6-fluoro-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	2-dimethylamino-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	4-dimethylamino-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	5-dimethylamino-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	6-dimethylamino-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	2-piperidino-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	4-piperidino-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	5-piperidino-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	6-piperidino-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	2-morpholino-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	4-morpholino-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	5-morpholino-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	6-morpholino-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	2-hydroxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	4-hydroxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	5-hydroxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOEt	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

O	propyl	OCOOEt	2-mercapto-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	4-mercapto-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	5-mercapto-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	6-mercapto-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2-methylthio-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	4-methylthio-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	5-methylthio-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	6-methylthio-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2,6-dimethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	5,6-dimethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2,6-diethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	5,6-diethyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2,6-diethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	5,6-diethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2,6-dichloro-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	5,6-dichloro-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2-methyl-4-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2-ethyl-4-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2-methoxy-4-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2-ethoxy-4-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2-chloro-4-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2-dimethylamino-4-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2-piperidino-4-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2-morpholino-4-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2-methylthio-4-pyridyl
O	propyl	OCOOEt	2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOEt	5-methyl-2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOEt	5-ethyl-2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOEt	5-methoxy-2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOEt	5-ethoxy-2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOEt	5-chloro-2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOEt	6-methyl-2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOEt	6-methoxy-2-pyrazinyl
O	propyl	OCOOEt	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
O	n-butyl	OH	2-pyridyl
O	n-butyl	OH	3-pyridyl
O	n-butyl	OH	4-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	4-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-ethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	4-ethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5-ethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	6-ethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-methoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	4-methoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5-methoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	6-methoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-ethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	4-ethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5-ethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	6-ethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-chloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	4-chloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5-chloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	6-chloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-fluoro-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	4-fluoro-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5-fluoro-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	6-fluoro-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	4-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	6-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-piperidino-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	4-piperidino-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5-piperidino-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	6-piperidino-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-morpholino-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	4-morpholino-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5-morpholino-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	6-morpholino-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-hydroxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	4-hydroxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5-hydroxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

O	n-butyl	OH	2-mercapto-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	4-mercapto-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5-mercapto-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	6-mercapto-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-methylthio-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	4-methylthio-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5-methylthio-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	6-methylthio-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2,6-dimethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5,6-dimethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2,6-diethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5,6-diethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2,6-diethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5,6-diethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2,6-dichloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5,6-dichloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-methyl-4-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-ethyl-4-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-methoxy-4-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-ethoxy-4-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-chloro-4-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-dimethylamino-4-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-piperidino-4-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-morpholino-4-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-methylthio-4-pyridyl
O	n-butyl	OH	2-pyrazinyl
O	n-butyl	OH	5-methyl-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OH	5-ethyl-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OH	5-methoxy-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OH	5-ethoxy-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OH	5-chloro-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OH	6-methyl-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OH	6-methoxy-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OH	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
O	n-butyl	OCOOMe	2-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	4-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	4-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-ethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	4-ethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-ethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-ethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-methoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	4-methoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-methoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-methoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-ethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	4-ethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-ethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-ethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-chloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	4-chloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-chloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-chloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-fluoro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	4-fluoro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-fluoro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-fluoro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	4-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-piperidino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	4-piperidino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-piperidino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-piperidino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-morpholino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	4-morpholino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-morpholino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-morpholino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-hydroxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	4-hydroxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-hydroxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40



O	n-butyl	OCOOMe	2-mercapto-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	4-mercapto-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-mercapto-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-mercapto-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-methylthio-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	4-methylthio-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-methylthio-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-methylthio-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2,6-dimethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5,6-dimethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2,6-diethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5,6-diethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2,6-diethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5,6-diethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2,6-dichloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5,6-dichloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-methyl-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-ethyl-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-methoxy-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-ethoxy-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-chloro-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-dimethylamino-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-piperidino-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-morpholino-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-methylthio-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOOMe	2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-methyl-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-ethyl-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-methoxy-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-ethoxy-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOOMe	5-chloro-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-methyl-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-methoxy-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOOMe	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
O	n-butyl	OCOEt	2-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	4-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	4-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	6-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-ethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	4-ethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5-ethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	6-ethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-methoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	4-methoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5-methoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	6-methoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-ethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	4-ethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5-ethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	6-ethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-chloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	4-chloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5-chloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	6-chloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-fluoro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	4-fluoro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5-fluoro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	6-fluoro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	4-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	6-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-piperidino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	4-piperidino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5-piperidino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	6-piperidino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-morpholino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	4-morpholino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5-morpholino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	6-morpholino-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-hydroxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	4-hydroxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5-hydroxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

O	n-butyl	OCOEt	2-mercapto-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	4-mercapto-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5-mercapto-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	6-mercapto-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-methylthio-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	4-methylthio-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5-methylthio-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	6-methylthio-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2,6-dimethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5,6-dimethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2,6-diethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5,6-diethyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2,6-diethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5,6-diethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2,6-dichloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5,6-dichloro-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-methyl-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-ethyl-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-methoxy-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-ethoxy-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-chloro-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-dimethylamino-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-piperidino-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-morpholino-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-methylthio-4-pyridyl
O	n-butyl	OCOEt	2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOEt	5-methyl-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOEt	5-ethyl-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOEt	5-methoxy-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOEt	5-ethoxy-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOEt	5-chloro-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOEt	6-methyl-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOEt	6-methoxy-2-pyrazinyl
O	n-butyl	OCOEt	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
O	n-pentyl	OH	2-pyridyl
O	n-pentyl	OH	3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	4-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	4-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-ethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	4-ethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5-ethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	6-ethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-methoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	4-methoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5-methoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	6-methoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-ethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	4-ethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5-ethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	6-ethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-chloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	4-chloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5-chloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	6-chloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-fluoro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	4-fluoro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5-fluoro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	6-fluoro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	4-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	6-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-piperidino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	4-piperidino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5-piperidino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	6-piperidino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-morpholino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	4-morpholino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5-morpholino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	6-morpholino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-hydroxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	4-hydroxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5-hydroxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

O	n-pentyl	OH	2-mercapto-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	4-mercapto-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5-mercapto-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	6-mercapto-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-methylthio-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	4-methylthio-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5-methylthio-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	6-methylthio-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2,6-dimethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5,6-dimethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2,6-diethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5,6-diethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2,6-diethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5,6-diethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2,6-dichloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5,6-dichloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-methyl-4-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-ethyl-4-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-methoxy-4-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-ethoxy-4-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-chloro-4-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-dimethylamino-4-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-piperidino-4-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-morpholino-4-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-methylthio-4-pyridyl
O	n-pentyl	OH	2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OH	5-methyl-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OH	5-ethyl-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OH	5-methoxy-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OH	5-ethoxy-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OH	5-chloro-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OH	6-methyl-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OH	6-methoxy-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OH	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
O	n-pentyl	OCOOMe	2-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	4-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-ethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	4-ethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-ethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-ethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-methoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	4-methoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-methoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-methoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-ethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	4-ethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-ethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-ethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-chloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	4-chloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-chloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-chloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-fluoro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	4-fluoro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-fluoro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-fluoro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	4-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-piperidino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	4-piperidino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-piperidino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-piperidino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-morpholino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	4-morpholino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-morpholino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-morpholino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-hydroxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	4-hydroxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-hydroxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

O	n-pentyl	OCOOMe	2-mercapto-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	4-mercapto-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-mercapto-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-mercapto-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-methylthio-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	4-methylthio-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-methylthio-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-methylthio-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2,6-dimethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5,6-dimethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2,6-diethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5,6-diethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2,6-diethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5,6-diethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2,6-dichloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5,6-dichloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-methyl-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-ethyl-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-methoxy-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-ethoxy-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-chloro-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-dimethylamino-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-piperidino-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-morpholino-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-methylthio-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOOMe	2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-methyl-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-ethyl-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-methoxy-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-ethoxy-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOOMe	5-chloro-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-methyl-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-methoxy-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOOMe	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
O	n-pentyl	OCOEt	2-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	4-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-ethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	4-ethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-ethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-ethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-methoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	4-methoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-methoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-methoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-ethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	4-ethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-ethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-ethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-chloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	4-chloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-chloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-chloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-fluoro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	4-fluoro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-fluoro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-fluoro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	4-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-dimethylamino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-piperidino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	4-piperidino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-piperidino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-piperidino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-morpholino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	4-morpholino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-morpholino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-morpholino-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-hydroxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	4-hydroxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-hydroxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40



O	n-pentyl	OCOEt	2-mercapto-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	4-mercapto-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-mercapto-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-mercapto-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-methylthio-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	4-methylthio-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-methylthio-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-methylthio-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2,6-dimethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5,6-dimethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2,6-diethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5,6-diethyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2,6-diethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5,6-diethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2,6-dichloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5,6-dichloro-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-methyl-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-ethyl-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-methoxy-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-ethoxy-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-chloro-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-dimethylamino-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-piperidino-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-morpholino-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-methylthio-4-pyridyl
O	n-pentyl	OCOEt	2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-methyl-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-ethyl-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-methoxy-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-ethoxy-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOEt	5-chloro-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-methyl-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-methoxy-2-pyrazinyl
O	n-pentyl	OCOEt	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	Y
S	propyl	OH	2-pyridyl
S	propyl	OH	3-pyridyl
S	propyl	OH	4-pyridyl
S	propyl	OH	2-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OH	4-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OH	5-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OH	2-ethyl-3-pyridyl
S	propyl	OH	4-ethyl-3-pyridyl
S	propyl	OH	5-ethyl-3-pyridyl
S	propyl	OH	6-ethyl-3-pyridyl
S	propyl	OH	2-methoxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	4-methoxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	5-methoxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	6-methoxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	2-ethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	4-ethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	5-ethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	6-ethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	2-chloro-3-pyridyl
S	propyl	OH	4-chloro-3-pyridyl
S	propyl	OH	5-chloro-3-pyridyl
S	propyl	OH	6-chloro-3-pyridyl
S	propyl	OH	2-fluoro-3-pyridyl
S	propyl	OH	4-fluoro-3-pyridyl
S	propyl	OH	5-fluoro-3-pyridyl
S	propyl	OH	6-fluoro-3-pyridyl
S	propyl	OH	2-dimethylamino-3-pyridyl
S	propyl	OH	4-dimethylamino-3-pyridyl
S	propyl	OH	5-dimethylamino-3-pyridyl
S	propyl	OH	6-dimethylamino-3-pyridyl
S	propyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	propyl	OH	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	propyl	OH	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	propyl	OH	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	propyl	OH	2-piperidino-3-pyridyl
S	propyl	OH	4-piperidino-3-pyridyl
S	propyl	OH	5-piperidino-3-pyridyl
S	propyl	OH	6-piperidino-3-pyridyl
S	propyl	OH	2-morpholino-3-pyridyl
S	propyl	OH	4-morpholino-3-pyridyl
S	propyl	OH	5-morpholino-3-pyridyl
S	propyl	OH	6-morpholino-3-pyridyl
S	propyl	OH	2-hydroxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	4-hydroxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	5-hydroxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

S	propyl	OH	2-mercapto-3-pyridyl
S	propyl	OH	4-mercapto-3-pyridyl
S	propyl	OH	5-mercapto-3-pyridyl
S	propyl	OH	6-mercapto-3-pyridyl
S	propyl	OH	2-methylthio-3-pyridyl
S	propyl	OH	4-methylthio-3-pyridyl
S	propyl	OH	5-methylthio-3-pyridyl
S	propyl	OH	6-methylthio-3-pyridyl
S	propyl	OH	2,6-dimethyl-3-pyridyl
S	propyl	OH	5,6-dimethyl-3-pyridyl
S	propyl	OH	2,6-diethyl-3-pyridyl
S	propyl	OH	5,6-diethyl-3-pyridyl
S	propyl	OH	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	2,6-diethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	5,6-diethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	2,6-dichloro-3-pyridyl
S	propyl	OH	5,6-dichloro-3-pyridyl
S	propyl	OH	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OH	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OH	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OH	2-methyl-4-pyridyl
S	propyl	OH	2-ethyl-4-pyridyl
S	propyl	OH	2-methoxy-4-pyridyl
S	propyl	OH	2-ethoxy-4-pyridyl
S	propyl	OH	2-chloro-4-pyridyl
S	propyl	OH	2-dimethylamino-4-pyridyl
S	propyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
S	propyl	OH	2-piperidino-4-pyridyl
S	propyl	OH	2-morpholino-4-pyridyl
S	propyl	OH	2-methylthio-4-pyridyl
S	propyl	OH	2-pyrazinyl
S	propyl	OH	5-methyl-2-pyrazinyl
S	propyl	OH	5-ethyl-2-pyrazinyl
S	propyl	OH	5-methoxy-2-pyrazinyl
S	propyl	OH	5-ethoxy-2-pyrazinyl
S	propyl	OH	5-chloro-2-pyrazinyl
S	propyl	OH	6-methyl-2-pyrazinyl
S	propyl	OH	6-methoxy-2-pyrazinyl
S	propyl	OH	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	Y
S	propyl	OCOOMe	2-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	4-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	4-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	6-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-ethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	4-ethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5-ethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	6-ethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-methoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	4-methoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5-methoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	6-methoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-ethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	4-ethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5-ethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	6-ethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-chloro-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	4-chloro-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5-chloro-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	6-chloro-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-fluoro-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	4-fluoro-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5-fluoro-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	6-fluoro-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-dimethylamino-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	4-dimethylamino-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5-dimethylamino-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	6-dimethylamino-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-piperidino-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	4-piperidino-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5-piperidino-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	6-piperidino-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-morpholino-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	4-morpholino-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5-morpholino-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	6-morpholino-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-hydroxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	4-hydroxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5-hydroxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

S	propyl	OCOOMe	2-mercapto-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	4-mercapto-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5-mercapto-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	6-mercapto-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-methylthio-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	4-methylthio-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5-methylthio-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	6-methylthio-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2,6-dimethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5,6-dimethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2,6-diethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5,6-diethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2,6-diethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5,6-diethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2,6-dichloro-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5,6-dichloro-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-methyl-4-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-ethyl-4-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-methoxy-4-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-ethoxy-4-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-chloro-4-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-dimethylamino-4-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-piperidino-4-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-morpholino-4-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-methylthio-4-pyridyl
S	propyl	OCOOMe	2-pyrazinyl
S	propyl	OCOOMe	5-methyl-2-pyrazinyl
S	propyl	OCOOMe	5-ethyl-2-pyrazinyl
S	propyl	OCOOMe	5-methoxy-2-pyrazinyl
S	propyl	OCOOMe	5-ethoxy-2-pyrazinyl
S	propyl	OCOOMe	5-chloro-2-pyrazinyl
S	propyl	OCOOMe	6-methyl-2-pyrazinyl
S	propyl	OCOOMe	6-methoxy-2-pyrazinyl
S	propyl	OCOOMe	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	Y
S	propyl	OCOEt	2-pyridyl
S	propyl	OCOEt	3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	4-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	4-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	6-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-ethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	4-ethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5-ethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	6-ethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-methoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	4-methoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5-methoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	6-methoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-ethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	4-ethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5-ethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	6-ethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-chloro-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	4-chloro-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5-chloro-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	6-chloro-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-fluoro-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	4-fluoro-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5-fluoro-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	6-fluoro-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-dimethylamino-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	4-dimethylamino-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5-dimethylamino-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	6-dimethylamino-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-piperidino-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	4-piperidino-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5-piperidino-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	6-piperidino-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-morpholino-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	4-morpholino-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5-morpholino-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	6-morpholino-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-hydroxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	4-hydroxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5-hydroxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

S	propyl	OCOEt	2-mercapto-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	4-mercapto-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5-mercapto-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	6-mercapto-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-methylthio-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	4-methylthio-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5-methylthio-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	6-methylthio-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2,6-dimethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5,6-dimethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2,6-diethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5,6-diethyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2,6-diethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5,6-diethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2,6-dichloro-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5,6-dichloro-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-methyl-4-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-ethyl-4-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-methoxy-4-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-ethoxy-4-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-chloro-4-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-dimethylamino-4-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-piperidino-4-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-morpholino-4-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-methylthio-4-pyridyl
S	propyl	OCOEt	2-pyrazinyl
S	propyl	OCOEt	5-methyl-2-pyrazinyl
S	propyl	OCOEt	5-ethyl-2-pyrazinyl
S	propyl	OCOEt	5-methoxy-2-pyrazinyl
S	propyl	OCOEt	5-ethoxy-2-pyrazinyl
S	propyl	OCOEt	5-chloro-2-pyrazinyl
S	propyl	OCOEt	6-methyl-2-pyrazinyl
S	propyl	OCOEt	6-methoxy-2-pyrazinyl
S	propyl	OCOEt	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	n-butyl	OH	2-pyridyl
S	n-butyl	OH	3-pyridyl
S	n-butyl	OH	4-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	4-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-ethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	4-ethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5-ethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	6-ethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-methoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	4-methoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5-methoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	6-methoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-ethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	4-ethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5-ethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	6-ethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-chloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	4-chloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5-chloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	6-chloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-fluoro-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	4-fluoro-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5-fluoro-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	6-fluoro-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	4-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	6-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-piperidino-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	4-piperidino-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5-piperidino-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	6-piperidino-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-morpholino-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	4-morpholino-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5-morpholino-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	6-morpholino-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-hydroxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	4-hydroxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5-hydroxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40



S	n-butyl	OH	2-mercapto-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	4-mercapto-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5-mercapto-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	6-mercapto-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-methylthio-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	4-methylthio-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5-methylthio-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	6-methylthio-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2,6-dimethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5,6-dimethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2,6-diethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5,6-diethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2,6-diethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5,6-diethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2,6-dichloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5,6-dichloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-methyl-4-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-ethyl-4-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-methoxy-4-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-ethoxy-4-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-chloro-4-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-dimethylamino-4-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-piperidino-4-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-morpholino-4-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-methylthio-4-pyridyl
S	n-butyl	OH	2-pyrazinyl
S	n-butyl	OH	5-methyl-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OH	5-ethyl-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OH	5-methoxy-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OH	5-ethoxy-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OH	5-chloro-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OH	6-methyl-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OH	6-methoxy-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OH	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	n-butyl	OCOOMe	2-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	6-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-ethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-ethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-ethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	6-ethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-methoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-methoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-methoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	6-methoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-ethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-ethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-ethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	6-ethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-chloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-chloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-chloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	6-chloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-fluoro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-fluoro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-fluoro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	6-fluoro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	6-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-piperidino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-piperidino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-piperidino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	6-piperidino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-morpholino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-morpholino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-morpholino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	6-morpholino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-hydroxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-hydroxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-hydroxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOMe	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

S	n-butyl	OCOOME	2-mercapto-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	4-mercapto-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	5-mercapto-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	6-mercapto-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2-methylthio-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	4-methylthio-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	5-methylthio-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	6-methylthio-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2,6-dimethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	5,6-dimethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2,6-diethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	5,6-diethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2,6-diethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	5,6-diethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2,6-dichloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	5,6-dichloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2-methyl-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2-ethyl-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2-methoxy-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2-ethoxy-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2-chloro-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2-dimethylamino-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2-piperidino-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2-morpholino-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2-methylthio-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOME	2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOME	5-methyl-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOME	5-ethyl-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOME	5-methoxy-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOME	5-ethoxy-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOME	5-chloro-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOME	6-methyl-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOME	6-methoxy-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOME	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	n-butyl	OCOEt	2-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	4-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	2-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	4-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	5-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	6-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	2-ethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	4-ethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	5-ethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	6-ethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	2-methoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	4-methoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	5-methoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	6-methoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	2-ethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	4-ethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	5-ethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	6-ethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	2-chloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	4-chloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	5-chloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	6-chloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	2-fluoro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	4-fluoro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	5-fluoro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	6-fluoro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	2-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	4-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	5-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	6-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	2-piperidino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	4-piperidino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	5-piperidino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	6-piperidino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	2-morpholino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	4-morpholino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	5-morpholino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	6-morpholino-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	2-hydroxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	4-hydroxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	5-hydroxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOEt	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

S	n-butyl	OCOOEt	2-mercapto-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	4-mercapto-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	5-mercapto-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	6-mercapto-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2-methylthio-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	4-methylthio-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	5-methylthio-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	6-methylthio-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2,6-dimethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	5,6-dimethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2,6-diethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	5,6-diethyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2,6-diethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	5,6-diethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2,6-dichloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	5,6-dichloro-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2-methyl-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2-ethyl-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2-methoxy-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2-ethoxy-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2-chloro-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2-dimethylamino-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2-piperidino-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2-morpholino-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2-methylthio-4-pyridyl
S	n-butyl	OCOOEt	2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOEt	5-methyl-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOEt	5-ethyl-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOEt	5-methoxy-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOEt	5-ethoxy-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOEt	5-chloro-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOEt	6-methyl-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOEt	6-methoxy-2-pyrazinyl
S	n-butyl	OCOOEt	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	n-pentyl	OH	2-pyridyl
S	n-pentyl	OH	3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	4-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	4-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-ethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	4-ethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5-ethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	6-ethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-methoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	4-methoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5-methoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	6-methoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-ethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	4-ethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5-ethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	6-ethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-chloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	4-chloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5-chloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	6-chloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-fluoro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	4-fluoro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5-fluoro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	6-fluoro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	4-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	6-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-piperidino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	4-piperidino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5-piperidino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	6-piperidino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-morpholino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	4-morpholino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5-morpholino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	6-morpholino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-hydroxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	4-hydroxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5-hydroxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

S	n-pentyl	OH	2-mercapto-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	4-mercapto-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5-mercapto-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	6-mercapto-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-methylthio-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	4-methylthio-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5-methylthio-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	6-methylthio-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2,6-dimethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5,6-dimethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2,6-diethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5,6-diethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2,6-diethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5,6-diethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2,6-dichloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5,6-dichloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-methyl-4-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-ethyl-4-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-methoxy-4-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-ethoxy-4-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-chloro-4-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-dimethylamino-4-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-piperidino-4-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-morpholino-4-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-methylthio-4-pyridyl
S	n-pentyl	OH	2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OH	5-methyl-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OH	5-ethyl-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OH	5-methoxy-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OH	5-ethoxy-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OH	5-chloro-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OH	6-methyl-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OH	6-methoxy-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OH	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	n-pentyl	OCOOMe	2-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	6-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-ethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-ethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-ethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	6-ethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-methoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-methoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-methoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	6-methoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-ethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-ethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-ethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	6-ethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-chloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-chloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-chloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	6-chloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-fluoro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-fluoro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-fluoro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	6-fluoro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	6-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-piperidino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-piperidino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-piperidino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	6-piperidino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-morpholino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-morpholino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-morpholino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	6-morpholino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-hydroxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-hydroxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-hydroxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOMe	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40



S	n-pentyl	OCOOME	2-mercapto-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	4-mercapto-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	5-mercapto-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	6-mercapto-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2-methylthio-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	4-methylthio-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	5-methylthio-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	6-methylthio-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2,6-dimethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	5,6-dimethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2,6-diethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	5,6-diethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2,6-diethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	5,6-diethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2,6-dichloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	5,6-dichloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2-methyl-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2-ethyl-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2-methoxy-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2-ethoxy-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2-chloro-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2-dimethylamino-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2-piperidino-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2-morpholino-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2-methylthio-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOOME	2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOOME	5-methyl-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOOME	5-ethyl-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOOME	5-methoxy-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOOME	5-ethoxy-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOOME	5-chloro-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOOME	6-methyl-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOOME	6-methoxy-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOOME	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	n-pentyl	OCOEt	2-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-ethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-ethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-ethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-ethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-methoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-methoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-methoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-methoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-ethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-ethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-ethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-ethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-chloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-chloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-chloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-chloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-fluoro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-fluoro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-fluoro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-fluoro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-dimethylamino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-piperidino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-piperidino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-piperidino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-piperidino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-morpholino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-morpholino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-morpholino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-morpholino-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-hydroxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-hydroxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-hydroxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-hydroxy-3-pyridyl

10

20

30

40

S	n-pentyl	OCOEt	2-mercapto-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-mercapto-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-mercapto-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-mercapto-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-methylthio-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-methylthio-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-methylthio-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-methylthio-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2,6-dimethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5,6-dimethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2,6-diethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5,6-diethyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2,6-diethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5,6-diethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2,6-dichloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5,6-dichloro-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-chloro-6-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-chloro-2-methyl-3-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-methyl-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-ethyl-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-methoxy-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-ethoxy-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-chloro-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-dimethylamino-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-piperidino-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-morpholino-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-methylthio-4-pyridyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-methyl-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-ethyl-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-methoxy-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-ethoxy-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-chloro-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-methyl-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-methoxy-2-pyrazinyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-chloro-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	2-methoxyethyl	OH	3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	4-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-methyl-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-ethyl-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	6-ethyl-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	6-methoxy-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	6-ethoxy-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-chloro-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	6-chloro-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	5,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	5,6-dichloro-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	6-dimethylamino-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	6-piperidino-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	6-morpholino-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	6-methylthio-3-pyridyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-pyrazinyl
NH	2-methoxyethyl	OH	5-methyl-2-pyrazinyl
NH	3-methoxypropyl	OH	3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	4-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-methyl-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-ethyl-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	6-ethyl-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-methoxy-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	6-methoxy-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	6-ethoxy-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-chloro-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	6-chloro-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	5,6-dimethyl-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	5,6-dichloro-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	6-dimethylamino-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	6-piperidino-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	6-morpholino-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	6-methylthio-3-pyridyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-pyrazinyl
NH	3-methoxypropyl	OH	5-methyl-2-pyrazinyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
O	2-methoxyethyl	OH	3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	4-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	2-methyl-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	2-ethyl-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	6-ethyl-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	6-methoxy-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	6-ethoxy-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	2-chloro-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	6-chloro-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	5,6-dimethyl-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	5,6-dichloro-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	6-dimethylamino-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	6-piperidino-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	6-morpholino-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	6-methylthio-3-pyridyl
O	2-methoxyethyl	OH	2-pyrazinyl
O	2-methoxyethyl	OH	5-methyl-2-pyrazinyl
O	3-methoxypropyl	OH	3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	4-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	2-methyl-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	2-ethyl-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	6-ethyl-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	2-methoxy-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	6-methoxy-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	6-ethoxy-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	2-chloro-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	6-chloro-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	5,6-dimethyl-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	5,6-dichloro-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	6-dimethylamino-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	6-piperidino-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	6-morpholino-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	6-methylthio-3-pyridyl
O	3-methoxypropyl	OH	2-pyrazinyl
O	3-methoxypropyl	OH	5-methyl-2-pyrazinyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	2-methoxyethyl	OH	3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	4-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-methyl-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-ethyl-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	6-ethyl-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	6-methoxy-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	6-ethoxy-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-chloro-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	6-chloro-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	5,6-dimethyl-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	5,6-dichloro-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	6-dimethylamino-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	6-piperidino-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	6-morpholino-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	6-methylthio-3-pyridyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-pyrazinyl
S	2-methoxyethyl	OH	5-methyl-2-pyrazinyl
S	2-hydroxyethyl	OH	3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	4-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-methyl-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	6-methyl-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-ethyl-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	6-ethyl-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-methoxy-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	6-methoxy-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	6-ethoxy-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-chloro-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	6-chloro-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	5,6-dimethyl-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	5,6-dimethoxy-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	5,6-dichloro-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	6-dimethylamino-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	6-piperidino-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	6-morpholino-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	6-methylthio-3-pyridyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-pyrazinyl
S	2-hydroxyethyl	OH	5-methyl-2-pyrazinyl

10

20

30

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	propyl	OH	1-naphthyl
NH	propyl	OH	2-naphthyl
NH	propyl	OH	2-pyrrolyl
NH	propyl	OH	3-pyrrolyl
NH	propyl	OH	2-furyl
NH	propyl	OH	3-furyl
NH	propyl	OH	2-thienyl
NH	propyl	OH	3-thienyl
NH	propyl	OH	3-pyrazolyl
NH	propyl	OH	4-pyrazolyl
NH	propyl	OH	2-imidazolyl
NH	propyl	OH	4-imidazolyl
NH	propyl	OH	2-oxazolyl
NH	propyl	OH	4-oxazolyl
NH	propyl	OH	5-oxazolyl
NH	propyl	OH	2-thiazolyl
NH	propyl	OH	4-thiazolyl
NH	propyl	OH	5-thiazolyl
NH	propyl	OH	2-pyrimidinyl
NH	propyl	OH	4-pyrimidinyl
NH	propyl	OH	5-pyrimidinyl
NH	propyl	OH	2-indolyl
NH	propyl	OH	3-indolyl
NH	propyl	OH	5-indolyl
NH	propyl	OH	6-indolyl
NH	propyl	OH	5-benzimidazolyl
NH	propyl	OH	2-benzofuryl
NH	propyl	OH	3-indazolyl
NH	propyl	OH	2-benzoxazolyl
NH	propyl	OH	4-fluoro-1-naphthyl
NH	propyl	OH	5-chloro-2-thienyl
NH	propyl	OH	4-methyl-1-naphthyl
NH	propyl	OH	1-methyl-2-pyrrolyl
NH	propyl	OH	2-methyl-3-furyl
NH	propyl	OH	5-methyl-2-thienyl
NH	propyl	OH	4-methyl-5-imidazolyl
NH	propyl	OH	1-methyl-3-indolyl
NH	propyl	OH	2-methoxy-1-naphthyl
NH	propyl	OH	3-methoxy-2-naphthyl
NH	propyl	OH	6-methoxy-2-naphthyl
NH	propyl	OH	5-methoxy-3-indolyl
NH	propyl	OH	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
NH	propyl	OH	5,6-dimethoxy-2-indolyl
NH	propyl	OH	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	propyl	OCOOMe	1-naphthyl
NH	propyl	OCOOMe	2-naphthyl
NH	propyl	OCOOMe	2-pyrrolyl
NH	propyl	OCOOMe	3-pyrrolyl
NH	propyl	OCOOMe	2-furyl
NH	propyl	OCOOMe	3-furyl
NH	propyl	OCOOMe	2-thienyl
NH	propyl	OCOOMe	3-thienyl
NH	propyl	OCOOMe	3-pyrazolyl
NH	propyl	OCOOMe	4-pyrazolyl
NH	propyl	OCOOMe	2-imidazolyl
NH	propyl	OCOOMe	4-imidazolyl
NH	propyl	OCOOMe	2-oxazolyl
NH	propyl	OCOOMe	4-oxazolyl
NH	propyl	OCOOMe	5-oxazolyl
NH	propyl	OCOOMe	2-thiazolyl
NH	propyl	OCOOMe	4-thiazolyl
NH	propyl	OCOOMe	5-thiazolyl
NH	propyl	OCOOMe	2-pyrimidinyl
NH	propyl	OCOOMe	4-pyrimidinyl
NH	propyl	OCOOMe	5-pyrimidinyl
NH	propyl	OCOOMe	2-indolyl
NH	propyl	OCOOMe	3-indolyl
NH	propyl	OCOOMe	5-indolyl
NH	propyl	OCOOMe	6-indolyl
NH	propyl	OCOOMe	5-benzimidazolyl
NH	propyl	OCOOMe	2-benzofuryl
NH	propyl	OCOOMe	3-indazolyl
NH	propyl	OCOOMe	2-benzoxazolyl
NH	propyl	OCOOMe	4-fluoro-1-naphthyl
NH	propyl	OCOOMe	5-chloro-2-thienyl
NH	propyl	OCOOMe	4-methyl-1-naphthyl
NH	propyl	OCOOMe	1-methyl-2-pyrrolyl
NH	propyl	OCOOMe	2-methyl-3-furyl
NH	propyl	OCOOMe	5-methyl-2-thienyl
NH	propyl	OCOOMe	4-methyl-5-imidazolyl
NH	propyl	OCOOMe	1-methyl-3-indolyl
NH	propyl	OCOOMe	2-methoxy-1-naphthyl
NH	propyl	OCOOMe	3-methoxy-2-naphthyl
NH	propyl	OCOOMe	6-methoxy-2-naphthyl
NH	propyl	OCOOMe	5-methoxy-3-indolyl
NH	propyl	OCOOMe	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
NH	propyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-2-indolyl
NH	propyl	OCOOMe	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40



X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	propyl	OCOEt	1-naphthyl
NH	propyl	OCOEt	2-naphthyl
NH	propyl	OCOEt	2-pyrrolyl
NH	propyl	OCOEt	3-pyrrolyl
NH	propyl	OCOEt	2-furyl
NH	propyl	OCOEt	3-furyl
NH	propyl	OCOEt	2-thienyl
NH	propyl	OCOEt	3-thienyl
NH	propyl	OCOEt	3-pyrazolyl
NH	propyl	OCOEt	4-pyrazolyl
NH	propyl	OCOEt	2-imidazolyl
NH	propyl	OCOEt	4-imidazolyl
NH	propyl	OCOEt	2-oxazolyl
NH	propyl	OCOEt	4-oxazolyl
NH	propyl	OCOEt	5-oxazolyl
NH	propyl	OCOEt	2-thiazolyl
NH	propyl	OCOEt	4-thiazolyl
NH	propyl	OCOEt	5-thiazolyl
NH	propyl	OCOEt	2-pyrimidinyl
NH	propyl	OCOEt	4-pyrimidinyl
NH	propyl	OCOEt	5-pyrimidinyl
NH	propyl	OCOEt	2-indolyl
NH	propyl	OCOEt	3-indolyl
NH	propyl	OCOEt	5-indolyl
NH	propyl	OCOEt	6-indolyl
NH	propyl	OCOEt	5-benzimidazolyl
NH	propyl	OCOEt	2-benzofuryl
NH	propyl	OCOEt	3-indazolyl
NH	propyl	OCOEt	2-benzoxazolyl
NH	propyl	OCOEt	4-fluoro-1-naphthyl
NH	propyl	OCOEt	5-chloro-2-thienyl
NH	propyl	OCOEt	4-methyl-1-naphthyl
NH	propyl	OCOEt	1-methyl-2-pyrrolyl
NH	propyl	OCOEt	2-methyl-3-furyl
NH	propyl	OCOEt	5-methyl-2-thienyl
NH	propyl	OCOEt	4-methyl-5-imidazolyl
NH	propyl	OCOEt	1-methyl-3-indolyl
NH	propyl	OCOEt	2-methoxy-1-naphthyl
NH	propyl	OCOEt	3-methoxy-2-naphthyl
NH	propyl	OCOEt	6-ethoxy-2-naphthyl
NH	propyl	OCOEt	5-methoxy-3-indolyl
NH	propyl	OCOEt	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
NH	propyl	OCOEt	5,6-dimethoxy-2-indolyl
NH	propyl	OCOEt	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	n-butyl	OH	1-naphthyl
NH	n-butyl	OH	2-naphthyl
NH	n-butyl	OH	2-pyrrolyl
NH	n-butyl	OH	3-pyrrolyl
NH	n-butyl	OH	2-furyl
NH	n-butyl	OH	3-furyl
NH	n-butyl	OH	2-thienyl
NH	n-butyl	OH	3-thienyl
NH	n-butyl	OH	3-pyrazolyl
NH	n-butyl	OH	4-pyrazolyl
NH	n-butyl	OH	2-imidazolyl
NH	n-butyl	OH	4-imidazolyl
NH	n-butyl	OH	2-oxazolyl
NH	n-butyl	OH	4-oxazolyl
NH	n-butyl	OH	5-oxazolyl
NH	n-butyl	OH	2-thiazolyl
NH	n-butyl	OH	4-thiazolyl
NH	n-butyl	OH	5-thiazolyl
NH	n-butyl	OH	2-pyrimidinyl
NH	n-butyl	OH	4-pyrimidinyl
NH	n-butyl	OH	5-pyrimidinyl
NH	n-butyl	OH	2-indolyl
NH	n-butyl	OH	3-indolyl
NH	n-butyl	OH	5-indolyl
NH	n-butyl	OH	6-indolyl
NH	n-butyl	OH	5-benzimidazolyl
NH	n-butyl	OH	2-benzofuryl
NH	n-butyl	OH	3-indazolyl
NH	n-butyl	OH	2-benzoxazolyl
NH	n-butyl	OH	4-fluoro-1-naphthyl
NH	n-butyl	OH	5-chloro-2-thienyl
NH	n-butyl	OH	4-methyl-1-naphthyl
NH	n-butyl	OH	1-methyl-2-pyrrolyl
NH	n-butyl	OH	2-methyl-3-furyl
NH	n-butyl	OH	5-methyl-2-thienyl
NH	n-butyl	OH	4-methyl-5-imidazolyl
NH	n-butyl	OH	1-methyl-3-indolyl
NH	n-butyl	OH	2-methoxy-1-naphthyl
NH	n-butyl	OH	3-methoxy-2-naphthyl
NH	n-butyl	OH	6-methoxy-2-naphthyl
NH	n-butyl	OH	5-methoxy-3-indolyl
NH	n-butyl	OH	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
NH	n-butyl	OH	5,6-dimethoxy-2-indolyl
NH	n-butyl	OH	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	n-butyl	OCOOMe	1-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-pyrrolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	3-pyrrolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-furyl
NH	n-butyl	OCOOMe	3-furyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-thienyl
NH	n-butyl	OCOOMe	3-thienyl
NH	n-butyl	OCOOMe	3-pyrazolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-pyrazolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-imidazolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-imidazolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-oxazolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-oxazolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-oxazolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-thiazolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-thiazolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-thiazolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-pyrimidinyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-pyrimidinyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-pyrimidinyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-indolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	3-indolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-indolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-indolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-benzimidazolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-benzofuryl
NH	n-butyl	OCOOMe	3-indazolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-benzoxazolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-fluoro-1-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-chloro-2-thienyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-methyl-1-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOMe	1-methyl-2-pyrrolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-methyl-3-furyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-methyl-2-thienyl
NH	n-butyl	OCOOMe	4-methyl-5-imidazolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	1-methyl-3-indolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	2-methoxy-1-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOMe	3-methoxy-2-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOMe	6-methoxy-2-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-methoxy-3-indolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-2-indolyl
NH	n-butyl	OCOOMe	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	n-butyl	OCOOEt	1-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-pyrrolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	3-pyrrolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-furyl
NH	n-butyl	OCOOEt	3-furyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-thienyl
NH	n-butyl	OCOOEt	3-thienyl
NH	n-butyl	OCOOEt	3-pyrazolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	4-pyrazolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-imidazolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	4-imidazolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-oxazolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	4-oxazolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-oxazolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-thiazolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	4-thiazolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-thiazolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-pyrimidinyl
NH	n-butyl	OCOOEt	4-pyrimidinyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-pyrimidinyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-indolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	3-indolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-indolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	6-indolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-benzimidazolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-benzofuryl
NH	n-butyl	OCOOEt	3-indazolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-benzoxazolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	4-fluoro-1-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-chloro-2-thienyl
NH	n-butyl	OCOOEt	4-methyl-1-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOEt	1-methyl-2-pyrrolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-methyl-3-furyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-methyl-2-thienyl
NH	n-butyl	OCOOEt	4-methyl-5-imidazolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	1-methyl-3-indolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	2-methoxy-1-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOEt	3-methoxy-2-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOEt	6-ethoxy-2-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-methoxy-3-indolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5,6-dimethoxy-2-indolyl
NH	n-butyl	OCOOEt	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	n-pentyl	OH	1-naphthyl
NH	n-pentyl	OH	2-naphthyl
NH	n-pentyl	OH	2-pyrrolyl
NH	n-pentyl	OH	3-pyrrolyl
NH	n-pentyl	OH	2-furyl
NH	n-pentyl	OH	3-furyl
NH	n-pentyl	OH	2-thienyl
NH	n-pentyl	OH	3-thienyl
NH	n-pentyl	OH	3-pyrazolyl
NH	n-pentyl	OH	4-pyrazolyl
NH	n-pentyl	OH	2-imidazolyl
NH	n-pentyl	OH	4-imidazolyl
NH	n-pentyl	OH	2-oxazolyl
NH	n-pentyl	OH	4-oxazolyl
NH	n-pentyl	OH	5-oxazolyl
NH	n-pentyl	OH	2-thiazolyl
NH	n-pentyl	OH	4-thiazolyl
NH	n-pentyl	OH	5-thiazolyl
NH	n-pentyl	OH	2-pyrimidinyl
NH	n-pentyl	OH	4-pyrimidinyl
NH	n-pentyl	OH	5-pyrimidinyl
NH	n-pentyl	OH	2-indolyl
NH	n-pentyl	OH	3-indolyl
NH	n-pentyl	OH	5-indolyl
NH	n-pentyl	OH	6-indolyl
NH	n-pentyl	OH	5-benzimidazolyl
NH	n-pentyl	OH	2-benzofuryl
NH	n-pentyl	OH	3-indazolyl
NH	n-pentyl	OH	2-benzoxazolyl
NH	n-pentyl	OH	4-fluoro-1-naphthyl
NH	n-pentyl	OH	5-chloro-2-thienyl
NH	n-pentyl	OH	4-methyl-1-naphthyl
NH	n-pentyl	OH	1-methyl-2-pyrrolyl
NH	n-pentyl	OH	2-methyl-3-furyl
NH	n-pentyl	OH	5-methyl-2-thienyl
NH	n-pentyl	OH	4-methyl-5-imidazolyl
NH	n-pentyl	OH	1-methyl-3-indolyl
NH	n-pentyl	OH	2-methoxy-1-naphthyl
NH	n-pentyl	OH	3-methoxy-2-naphthyl
NH	n-pentyl	OH	6-ethoxy-2-naphthyl
NH	n-pentyl	OH	5-methoxy-3-indolyl
NH	n-pentyl	OH	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
NH	n-pentyl	OH	5,6-dimethoxy-2-indolyl
NH	n-pentyl	OH	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	n-pentyl	OCOOMe	1-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-pyrrolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	3-pyrrolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-furyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	3-furyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-thienyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	3-thienyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	3-pyrazolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-pyrazolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-imidazolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-imidazolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-oxazolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-oxazolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-oxazolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-thiazolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-thiazolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-thiazolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-pyrimidinyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-pyrimidinyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-pyrimidinyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-indolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	3-indolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-indolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-indolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-benzimidazolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-benzofuryl
NH	n-pentyl	OCOOMe	3-indazolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-benzoxazolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-fluoro-1-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-chloro-2-thienyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-methyl-1-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	1-methyl-2-pyrrolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-methyl-3-furyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-methyl-2-thienyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	4-methyl-5-imidazolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	1-methyl-3-indolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	2-methoxy-1-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	3-methoxy-2-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	6-methoxy-2-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-methoxy-3-indolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-2-indolyl
NH	n-pentyl	OCOOMe	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	n-pentyl	OCOEt	1-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-pyrrolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	3-pyrrolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-furyl
NH	n-pentyl	OCOEt	3-furyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-thienyl
NH	n-pentyl	OCOEt	3-thienyl
NH	n-pentyl	OCOEt	3-pyrazolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-pyrazolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-imidazolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-imidazolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-oxazolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-oxazolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-oxazolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-thiazolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-thiazolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-thiazolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-pyrimidinyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-pyrimidinyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-pyrimidinyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-indolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	3-indolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-indolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	6-indolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-benzimidazolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-benzofuryl
NH	n-pentyl	OCOEt	3-indazolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-benzoxazolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-fluoro-1-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-chloro-2-thienyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-methyl-1-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOEt	1-methyl-2-pyrrolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-methyl-3-furyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-methyl-2-thienyl
NH	n-pentyl	OCOEt	4-methyl-5-imidazolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	1-methyl-3-indolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	2-methoxy-1-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOEt	3-methoxy-2-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOEt	6-ethoxy-2-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-methoxy-3-indolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5,6-dimethoxy-2-indolyl
NH	n-pentyl	OCOEt	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
○	propyl	OH	1-naphthyl
○	propyl	OH	2-naphthyl
○	propyl	OH	2-pyrrolyl
○	propyl	OH	3-pyrrolyl
○	propyl	OH	2-furyl
○	propyl	OH	3-furyl
○	propyl	OH	2-thienyl
○	propyl	OH	3-thienyl
○	propyl	OH	3-pyrazolyl
○	propyl	OH	4-pyrazolyl
○	propyl	OH	2-imidazolyl
○	propyl	OH	4-imidazolyl
○	propyl	OH	2-oxazolyl
○	propyl	OH	4-oxazolyl
○	propyl	OH	5-oxazolyl
○	propyl	OH	2-thiazolyl
○	propyl	OH	4-thiazolyl
○	propyl	OH	5-thiazolyl
○	propyl	OH	2-pyrimidinyl
○	propyl	OH	4-pyrimidinyl
○	propyl	OH	5-pyrimidinyl
○	propyl	OH	2-indolyl
○	propyl	OH	3-indolyl
○	propyl	OH	5-indolyl
○	propyl	OH	6-indolyl
○	propyl	OH	5-benzimidazolyl
○	propyl	OH	2-benzofuryl
○	propyl	OH	3-indazolyl
○	propyl	OH	2-benzoxazolyl
○	propyl	OH	4-fluoro-1-naphthyl
○	propyl	OH	5-chloro-2-thienyl
○	propyl	OH	4-methyl-1-naphthyl
○	propyl	OH	1-methyl-2-pyrrolyl
○	propyl	OH	2-methyl-3-furyl
○	propyl	OH	5-methyl-2-thienyl
○	propyl	OH	4-methyl-5-imidazolyl
○	propyl	OH	1-methyl-3-indolyl
○	propyl	OH	2-methoxy-1-naphthyl
○	propyl	OH	3-methoxy-2-naphthyl
○	propyl	OH	6-ethoxy-2-naphthyl
○	propyl	OH	5-methoxy-3-indolyl
○	propyl	OH	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
○	propyl	OH	5,6-dimethoxy-2-indolyl
○	propyl	OH	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40



X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
○	propyl	OCOOMe	1-naphthyl
○	propyl	OCOOMe	2-naphthyl
○	propyl	OCOOMe	2-pyrrolyl
○	propyl	OCOOMe	3-pyrrolyl
○	propyl	OCOOMe	2-furyl
○	propyl	OCOOMe	3-furyl
○	propyl	OCOOMe	2-thienyl
○	propyl	OCOOMe	3-thienyl
○	propyl	OCOOMe	3-pyrazolyl
○	propyl	OCOOMe	4-pyrazolyl
○	propyl	OCOOMe	2-imidazolyl
○	propyl	OCOOMe	4-imidazolyl
○	propyl	OCOOMe	2-oxazolyl
○	propyl	OCOOMe	4-oxazolyl
○	propyl	OCOOMe	5-oxazolyl
○	propyl	OCOOMe	2-thiazolyl
○	propyl	OCOOMe	4-thiazolyl
○	propyl	OCOOMe	5-thiazolyl
○	propyl	OCOOMe	2-pyrimidinyl
○	propyl	OCOOMe	4-pyrimidinyl
○	propyl	OCOOMe	5-pyrimidinyl
○	propyl	OCOOMe	2-indolyl
○	propyl	OCOOMe	3-indolyl
○	propyl	OCOOMe	5-indolyl
○	propyl	OCOOMe	6-indolyl
○	propyl	OCOOMe	5-benzimidazolyl
○	propyl	OCOOMe	2-benzofuryl
○	propyl	OCOOMe	3-indazolyl
○	propyl	OCOOMe	2-benzoxazolyl
○	propyl	OCOOMe	4-fluoro-1-naphthyl
○	propyl	OCOOMe	5-chloro-2-thienyl
○	propyl	OCOOMe	4-methyl-1-naphthyl
○	propyl	OCOOMe	1-methyl-2-pyrrolyl
○	propyl	OCOOMe	2-methyl-3-furyl
○	propyl	OCOOMe	5-methyl-2-thienyl
○	propyl	OCOOMe	4-methyl-5-imidazolyl
○	propyl	OCOOMe	1-methyl-3-indolyl
○	propyl	OCOOMe	2-methoxy-1-naphthyl
○	propyl	OCOOMe	3-methoxy-2-naphthyl
○	propyl	OCOOMe	6-ethoxy-2-naphthyl
○	propyl	OCOOMe	5-methoxy-3-indolyl
○	propyl	OCOOMe	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
○	propyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-2-indolyl
○	propyl	OCOOMe	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
○	propyl	OCOEt	1-naphthyl
○	propyl	OCOEt	2-naphthyl
○	propyl	OCOEt	2-pyrrolyl
○	propyl	OCOEt	3-pyrrolyl
○	propyl	OCOEt	2-furyl
○	propyl	OCOEt	3-furyl
○	propyl	OCOEt	2-thienyl
○	propyl	OCOEt	3-thienyl
○	propyl	OCOEt	3-pyrazolyl
○	propyl	OCOEt	4-pyrazolyl
○	propyl	OCOEt	2-imidazolyl
○	propyl	OCOEt	4-imidazolyl
○	propyl	OCOEt	2-oxazolyl
○	propyl	OCOEt	4-oxazolyl
○	propyl	OCOEt	5-oxazolyl
○	propyl	OCOEt	2-thiazolyl
○	propyl	OCOEt	4-thiazolyl
○	propyl	OCOEt	5-thiazolyl
○	propyl	OCOEt	2-pyrimidinyl
○	propyl	OCOEt	4-pyrimidinyl
○	propyl	OCOEt	5-pyrimidinyl
○	propyl	OCOEt	2-indolyl
○	propyl	OCOEt	3-indolyl
○	propyl	OCOEt	5-indolyl
○	propyl	OCOEt	6-indolyl
○	propyl	OCOEt	5-benzimidazolyl
○	propyl	OCOEt	2-benzofuryl
○	propyl	OCOEt	3-indazolyl
○	propyl	OCOEt	2-benzoxazolyl
○	propyl	OCOEt	4-fluoro-1-naphthyl
○	propyl	OCOEt	5-chloro-2-thienyl
○	propyl	OCOEt	4-methyl-1-naphthyl
○	propyl	OCOEt	1-methyl-2-pyrrolyl
○	propyl	OCOEt	2-methyl-3-furyl
○	propyl	OCOEt	5-methyl-2-thienyl
○	propyl	OCOEt	4-methyl-5-imidazolyl
○	propyl	OCOEt	1-methyl-3-indolyl
○	propyl	OCOEt	2-methoxy-1-naphthyl
○	propyl	OCOEt	3-methoxy-2-naphthyl
○	propyl	OCOEt	6-ethoxy-2-naphthyl
○	propyl	OCOEt	5-methoxy-3-indolyl
○	propyl	OCOEt	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
○	propyl	OCOEt	5,6-dimethoxy-2-indolyl
○	propyl	OCOEt	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
○	n-butyl	OH	1-naphthyl
○	n-butyl	OH	2-naphthyl
○	n-butyl	OH	2-pyrrolyl
○	n-butyl	OH	3-pyrrolyl
○	n-butyl	OH	2-furyl
○	n-butyl	OH	3-furyl
○	n-butyl	OH	2-thienyl
○	n-butyl	OH	3-thienyl
○	n-butyl	OH	3-pyrazolyl
○	n-butyl	OH	4-pyrazolyl
○	n-butyl	OH	2-imidazolyl
○	n-butyl	OH	4-imidazolyl
○	n-butyl	OH	2-oxazolyl
○	n-butyl	OH	4-oxazolyl
○	n-butyl	OH	5-oxazolyl
○	n-butyl	OH	2-thiazolyl
○	n-butyl	OH	4-thiazolyl
○	n-butyl	OH	5-thiazolyl
○	n-butyl	OH	2-pyrimidinyl
○	n-butyl	OH	4-pyrimidinyl
○	n-butyl	OH	5-pyrimidinyl
○	n-butyl	OH	2-indolyl
○	n-butyl	OH	3-indolyl
○	n-butyl	OH	5-indolyl
○	n-butyl	OH	6-indolyl
○	n-butyl	OH	5-benzimidazolyl
○	n-butyl	OH	2-benzofuryl
○	n-butyl	OH	3-indazolyl
○	n-butyl	OH	2-benzoxazolyl
○	n-butyl	OH	4-fluoro-1-naphthyl
○	n-butyl	OH	5-chloro-2-thienyl
○	n-butyl	OH	4-methyl-1-naphthyl
○	n-butyl	OH	1-methyl-2-pyrrolyl
○	n-butyl	OH	2-methyl-3-furyl
○	n-butyl	OH	5-methyl-2-thienyl
○	n-butyl	OH	4-methyl-5-imidazolyl
○	n-butyl	OH	1-methyl-3-indolyl
○	n-butyl	OH	2-methoxy-1-naphthyl
○	n-butyl	OH	3-methoxy-2-naphthyl
○	n-butyl	OH	6-methoxy-2-naphthyl
○	n-butyl	OH	5-methoxy-3-indolyl
○	n-butyl	OH	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
○	n-butyl	OH	5,6-dimethoxy-2-indolyl
○	n-butyl	OH	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
○	n-butyl	OCOOMe	1-naphthyl
○	n-butyl	OCOOMe	2-naphthyl
○	n-butyl	OCOOMe	2-pyrrolyl
○	n-butyl	OCOOMe	3-pyrrolyl
○	n-butyl	OCOOMe	2-furyl
○	n-butyl	OCOOMe	3-furyl
○	n-butyl	OCOOMe	2-thienyl
○	n-butyl	OCOOMe	3-thienyl
○	n-butyl	OCOOMe	3-pyrazolyl
○	n-butyl	OCOOMe	4-pyrazolyl
○	n-butyl	OCOOMe	2-imidazolyl
○	n-butyl	OCOOMe	4-imidazolyl
○	n-butyl	OCOOMe	2-oxazolyl
○	n-butyl	OCOOMe	4-oxazolyl
○	n-butyl	OCOOMe	5-oxazolyl
○	n-butyl	OCOOMe	2-thiazolyl
○	n-butyl	OCOOMe	4-thiazolyl
○	n-butyl	OCOOMe	5-thiazolyl
○	n-butyl	OCOOMe	2-pyrimidinyl
○	n-butyl	OCOOMe	4-pyrimidinyl
○	n-butyl	OCOOMe	5-pyrimidinyl
○	n-butyl	OCOOMe	2-indolyl
○	n-butyl	OCOOMe	3-indolyl
○	n-butyl	OCOOMe	5-indolyl
○	n-butyl	OCOOMe	6-indolyl
○	n-butyl	OCOOMe	5-benzimidazolyl
○	n-butyl	OCOOMe	2-benzofuryl
○	n-butyl	OCOOMe	3-indazolyl
○	n-butyl	OCOOMe	2-benzoxazolyl
○	n-butyl	OCOOMe	4-fluoro-1-naphthyl
○	n-butyl	OCOOMe	5-chloro-2-thienyl
○	n-butyl	OCOOMe	4-methyl-1-naphthyl
○	n-butyl	OCOOMe	1-methyl-2-pyrrolyl
○	n-butyl	OCOOMe	2-methyl-3-furyl
○	n-butyl	OCOOMe	5-methyl-2-thienyl
○	n-butyl	OCOOMe	4-methyl-5-imidazolyl
○	n-butyl	OCOOMe	1-methyl-3-indolyl
○	n-butyl	OCOOMe	2-methoxy-1-naphthyl
○	n-butyl	OCOOMe	3-methoxy-2-naphthyl
○	n-butyl	OCOOMe	6-ethoxy-2-naphthyl
○	n-butyl	OCOOMe	5-methoxy-3-indolyl
○	n-butyl	OCOOMe	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
○	n-butyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-2-indolyl
○	n-butyl	OCOOMe	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
○	n-butyl	OCOEt	1-naphthyl
○	n-butyl	OCOEt	2-naphthyl
○	n-butyl	OCOEt	2-pyrrolyl
○	n-butyl	OCOEt	3-pyrrolyl
○	n-butyl	OCOEt	2-furyl
○	n-butyl	OCOEt	3-furyl
○	n-butyl	OCOEt	2-thienyl
○	n-butyl	OCOEt	3-thienyl
○	n-butyl	OCOEt	3-pyrazolyl
○	n-butyl	OCOEt	4-pyrazolyl
○	n-butyl	OCOEt	2-imidazolyl
○	n-butyl	OCOEt	4-imidazolyl
○	n-butyl	OCOEt	2-oxazolyl
○	n-butyl	OCOEt	4-oxazolyl
○	n-butyl	OCOEt	5-oxazolyl
○	n-butyl	OCOEt	2-thiazolyl
○	n-butyl	OCOEt	4-thiazolyl
○	n-butyl	OCOEt	5-thiazolyl
○	n-butyl	OCOEt	2-pyrimidinyl
○	n-butyl	OCOEt	4-pyrimidinyl
○	n-butyl	OCOEt	5-pyrimidinyl
○	n-butyl	OCOEt	2-indolyl
○	n-butyl	OCOEt	3-indolyl
○	n-butyl	OCOEt	5-indolyl
○	n-butyl	OCOEt	6-indolyl
○	n-butyl	OCOEt	5-benzimidazolyl
○	n-butyl	OCOEt	2-benzofuryl
○	n-butyl	OCOEt	3-indazolyl
○	n-butyl	OCOEt	2-benzoxazolyl
○	n-butyl	OCOEt	4-fluoro-1-naphthyl
○	n-butyl	OCOEt	5-chloro-2-thienyl
○	n-butyl	OCOEt	4-methyl-1-naphthyl
○	n-butyl	OCOEt	1-methyl-2-pyrrolyl
○	n-butyl	OCOEt	2-methyl-3-furyl
○	n-butyl	OCOEt	5-methyl-2-thienyl
○	n-butyl	OCOEt	4-methyl-5-imidazolyl
○	n-butyl	OCOEt	1-methyl-3-indolyl
○	n-butyl	OCOEt	2-methoxy-1-naphthyl
○	n-butyl	OCOEt	3-methoxy-2-naphthyl
○	n-butyl	OCOEt	6-ethoxy-2-naphthyl
○	n-butyl	OCOEt	5-methoxy-3-indolyl
○	n-butyl	OCOEt	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
○	n-butyl	OCOEt	5,6-dimethoxy-2-indolyl
○	n-butyl	OCOEt	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
○	n-pentyl	OH	1-naphthyl
○	n-pentyl	OH	2-naphthyl
○	n-pentyl	OH	2-pyrrolyl
○	n-pentyl	OH	3-pyrrolyl
○	n-pentyl	OH	2-furyl
○	n-pentyl	OH	3-furyl
○	n-pentyl	OH	2-thienyl
○	n-pentyl	OH	3-thienyl
○	n-pentyl	OH	3-pyrazolyl
○	n-pentyl	OH	4-pyrazolyl
○	n-pentyl	OH	2-imidazolyl
○	n-pentyl	OH	4-imidazolyl
○	n-pentyl	OH	2-oxazolyl
○	n-pentyl	OH	4-oxazolyl
○	n-pentyl	OH	5-oxazolyl
○	n-pentyl	OH	2-thiazolyl
○	n-pentyl	OH	4-thiazolyl
○	n-pentyl	OH	5-thiazolyl
○	n-pentyl	OH	2-pyrimidinyl
○	n-pentyl	OH	4-pyrimidinyl
○	n-pentyl	OH	5-pyrimidinyl
○	n-pentyl	OH	2-indolyl
○	n-pentyl	OH	3-indolyl
○	n-pentyl	OH	5-indolyl
○	n-pentyl	OH	6-indolyl
○	n-pentyl	OH	5-benzimidazolyl
○	n-pentyl	OH	2-benzofuryl
○	n-pentyl	OH	3-indazolyl
○	n-pentyl	OH	2-benzoxazolyl
○	n-pentyl	OH	4-fluoro-1-naphthyl
○	n-pentyl	OH	5-chloro-2-thienyl
○	n-pentyl	OH	4-methyl-1-naphthyl
○	n-pentyl	OH	1-methyl-2-pyrrolyl
○	n-pentyl	OH	2-methyl-3-furyl
○	n-pentyl	OH	5-methyl-2-thienyl
○	n-pentyl	OH	4-methyl-5-imidazolyl
○	n-pentyl	OH	1-methyl-3-indolyl
○	n-pentyl	OH	2-methoxy-1-naphthyl
○	n-pentyl	OH	3-methoxy-2-naphthyl
○	n-pentyl	OH	6-methoxy-2-naphthyl
○	n-pentyl	OH	5-methoxy-3-indolyl
○	n-pentyl	OH	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
○	n-pentyl	OH	5,6-dimethoxy-2-indolyl
○	n-pentyl	OH	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
○	n-pentyl	OCOOMe	1-naphthyl
○	n-pentyl	OCOOMe	2-naphthyl
○	n-pentyl	OCOOMe	2-pyrrolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	3-pyrrolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	2-furyl
○	n-pentyl	OCOOMe	3-furyl
○	n-pentyl	OCOOMe	2-thienyl
○	n-pentyl	OCOOMe	3-thienyl
○	n-pentyl	OCOOMe	3-pyrazolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	4-pyrazolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	2-imidazolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	4-imidazolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	2-oxazolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	4-oxazolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	5-oxazolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	2-thiazolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	4-thiazolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	5-thiazolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	2-pyrimidinyl
○	n-pentyl	OCOOMe	4-pyrimidinyl
○	n-pentyl	OCOOMe	5-pyrimidinyl
○	n-pentyl	OCOOMe	2-indolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	3-indolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	5-indolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	6-indolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	5-benzimidazolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	2-benzofuryl
○	n-pentyl	OCOOMe	3-indazolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	2-benzoxazolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	4-fluoro-1-naphthyl
○	n-pentyl	OCOOMe	5-chloro-2-thienyl
○	n-pentyl	OCOOMe	4-methyl-1-naphthyl
○	n-pentyl	OCOOMe	1-methyl-2-pyrrolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	2-methyl-3-furyl
○	n-pentyl	OCOOMe	5-methyl-2-thienyl
○	n-pentyl	OCOOMe	4-methyl-5-imidazolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	1-methyl-3-indolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	2-methoxy-1-naphthyl
○	n-pentyl	OCOOMe	3-methoxy-2-naphthyl
○	n-pentyl	OCOOMe	6-methoxy-2-naphthyl
○	n-pentyl	OCOOMe	5-methoxy-3-indolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
○	n-pentyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-2-indolyl
○	n-pentyl	OCOOMe	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
○	n-pentyl	OCOEt	1-naphthyl
○	n-pentyl	OCOEt	2-naphthyl
○	n-pentyl	OCOEt	2-pyrrolyl
○	n-pentyl	OCOEt	3-pyrrolyl
○	n-pentyl	OCOEt	2-furyl
○	n-pentyl	OCOEt	3-furyl
○	n-pentyl	OCOEt	2-thienyl
○	n-pentyl	OCOEt	3-thienyl
○	n-pentyl	OCOEt	3-pyrazolyl
○	n-pentyl	OCOEt	4-pyrazolyl
○	n-pentyl	OCOEt	2-imidazolyl
○	n-pentyl	OCOEt	4-imidazolyl
○	n-pentyl	OCOEt	2-oxazolyl
○	n-pentyl	OCOEt	4-oxazolyl
○	n-pentyl	OCOEt	5-oxazolyl
○	n-pentyl	OCOEt	2-thiazolyl
○	n-pentyl	OCOEt	4-thiazolyl
○	n-pentyl	OCOEt	5-thiazolyl
○	n-pentyl	OCOEt	2-pyrimidinyl
○	n-pentyl	OCOEt	4-pyrimidinyl
○	n-pentyl	OCOEt	5-pyrimidinyl
○	n-pentyl	OCOEt	2-indolyl
○	n-pentyl	OCOEt	3-indolyl
○	n-pentyl	OCOEt	5-indolyl
○	n-pentyl	OCOEt	6-indolyl
○	n-pentyl	OCOEt	5-benzimidazolyl
○	n-pentyl	OCOEt	2-benzofuryl
○	n-pentyl	OCOEt	3-indazolyl
○	n-pentyl	OCOEt	2-benzoxazolyl
○	n-pentyl	OCOEt	4-fluoro-1-naphthyl
○	n-pentyl	OCOEt	5-chloro-2-thienyl
○	n-pentyl	OCOEt	4-methyl-1-naphthyl
○	n-pentyl	OCOEt	1-methyl-2-pyrrolyl
○	n-pentyl	OCOEt	2-methyl-3-furyl
○	n-pentyl	OCOEt	5-methyl-2-thienyl
○	n-pentyl	OCOEt	4-methyl-5-imidazolyl
○	n-pentyl	OCOEt	1-methyl-3-indolyl
○	n-pentyl	OCOEt	2-methoxy-1-naphthyl
○	n-pentyl	OCOEt	3-methoxy-2-naphthyl
○	n-pentyl	OCOEt	6-methoxy-2-naphthyl
○	n-pentyl	OCOEt	5-methoxy-3-indolyl
○	n-pentyl	OCOEt	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
○	n-pentyl	OCOEt	5,6-dimethoxy-2-indolyl
○	n-pentyl	OCOEt	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40



X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	propyl	OH	1-naphthyl
S	propyl	OH	2-naphthyl
S	propyl	OH	2-pyrrolyl
S	propyl	OH	3-pyrrolyl
S	propyl	OH	2-furyl
S	propyl	OH	3-furyl
S	propyl	OH	2-thienyl
S	propyl	OH	3-thienyl
S	propyl	OH	3-pyrazolyl
S	propyl	OH	4-pyrazolyl
S	propyl	OH	2-imidazolyl
S	propyl	OH	4-imidazolyl
S	propyl	OH	2-oxazolyl
S	propyl	OH	4-oxazolyl
S	propyl	OH	5-oxazolyl
S	propyl	OH	2-thiazolyl
S	propyl	OH	4-thiazolyl
S	propyl	OH	5-thiazolyl
S	propyl	OH	2-pyrimidinyl
S	propyl	OH	4-pyrimidinyl
S	propyl	OH	5-pyrimidinyl
S	propyl	OH	2-indolyl
S	propyl	OH	3-indolyl
S	propyl	OH	5-indolyl
S	propyl	OH	6-indolyl
S	propyl	OH	5-benzimidazolyl
S	propyl	OH	2-benzofuryl
S	propyl	OH	3-indazolyl
S	propyl	OH	2-benzoxazolyl
S	propyl	OH	4-fluoro-1-naphthyl
S	propyl	OH	5-chloro-2-thienyl
S	propyl	OH	4-methyl-1-naphthyl
S	propyl	OH	1-methyl-2-pyrrolyl
S	propyl	OH	2-methyl-3-furyl
S	propyl	OH	5-methyl-2-thienyl
S	propyl	OH	4-methyl-5-imidazolyl
S	propyl	OH	1-methyl-3-indolyl
S	propyl	OH	2-methoxy-1-naphthyl
S	propyl	OH	3-methoxy-2-naphthyl
S	propyl	OH	6-ethoxy-2-naphthyl
S	propyl	OH	5-methoxy-3-indolyl
S	propyl	OH	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
S	propyl	OH	5,6-dimethoxy-2-indolyl
S	propyl	OH	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	propyl	OCOOMe	1-naphthyl
S	propyl	OCOOMe	2-naphthyl
S	propyl	OCOOMe	2-pyrrolyl
S	propyl	OCOOMe	3-pyrrolyl
S	propyl	OCOOMe	2-furyl
S	propyl	OCOOMe	3-furyl
S	propyl	OCOOMe	2-thienyl
S	propyl	OCOOMe	3-thienyl
S	propyl	OCOOMe	3-pyrazolyl
S	propyl	OCOOMe	4-pyrazolyl
S	propyl	OCOOMe	2-imidazolyl
S	propyl	OCOOMe	4-imidazolyl
S	propyl	OCOOMe	2-oxazolyl
S	propyl	OCOOMe	4-oxazolyl
S	propyl	OCOOMe	5-oxazolyl
S	propyl	OCOOMe	2-thiazolyl
S	propyl	OCOOMe	4-thiazolyl
S	propyl	OCOOMe	5-thiazolyl
S	propyl	OCOOMe	2-pyrimidinyl
S	propyl	OCOOMe	4-pyrimidinyl
S	propyl	OCOOMe	5-pyrimidinyl
S	propyl	OCOOMe	2-indolyl
S	propyl	OCOOMe	3-indolyl
S	propyl	OCOOMe	5-indolyl
S	propyl	OCOOMe	6-indolyl
S	propyl	OCOOMe	5-benzimidazolyl
S	propyl	OCOOMe	2-benzofuryl
S	propyl	OCOOMe	3-indazolyl
S	propyl	OCOOMe	2-benzoxazolyl
S	propyl	OCOOMe	4-fluoro-1-naphthyl
S	propyl	OCOOMe	5-chloro-2-thienyl
S	propyl	OCOOMe	4-methyl-1-naphthyl
S	propyl	OCOOMe	1-methyl-2-pyrrolyl
S	propyl	OCOOMe	2-methyl-3-furyl
S	propyl	OCOOMe	5-methyl-2-thienyl
S	propyl	OCOOMe	4-methyl-5-imidazolyl
S	propyl	OCOOMe	1-methyl-3-indolyl
S	propyl	OCOOMe	2-methoxy-1-naphthyl
S	propyl	OCOOMe	3-methoxy-2-naphthyl
S	propyl	OCOOMe	6-ethoxy-2-naphthyl
S	propyl	OCOOMe	5-methoxy-3-indolyl
S	propyl	OCOOMe	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
S	propyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-2-indolyl
S	propyl	OCOOMe	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	propyl	OCOEt	1-naphthyl
S	propyl	OCOEt	2-naphthyl
S	propyl	OCOEt	2-pyrrolyl
S	propyl	OCOEt	3-pyrrolyl
S	propyl	OCOEt	2-furyl
S	propyl	OCOEt	3-furyl
S	propyl	OCOEt	2-thienyl
S	propyl	OCOEt	3-thienyl
S	propyl	OCOEt	3-pyrazolyl
S	propyl	OCOEt	4-pyrazolyl
S	propyl	OCOEt	2-imidazolyl
S	propyl	OCOEt	4-imidazolyl
S	propyl	OCOEt	2-oxazolyl
S	propyl	OCOEt	4-oxazolyl
S	propyl	OCOEt	5-oxazolyl
S	propyl	OCOEt	2-thiazolyl
S	propyl	OCOEt	4-thiazolyl
S	propyl	OCOEt	5-thiazolyl
S	propyl	OCOEt	2-pyrimidinyl
S	propyl	OCOEt	4-pyrimidinyl
S	propyl	OCOEt	5-pyrimidinyl
S	propyl	OCOEt	2-indolyl
S	propyl	OCOEt	3-indolyl
S	propyl	OCOEt	5-indolyl
S	propyl	OCOEt	6-indolyl
S	propyl	OCOEt	5-benzimidazolyl
S	propyl	OCOEt	2-benzofuryl
S	propyl	OCOEt	3-indazolyl
S	propyl	OCOEt	2-benzoxazolyl
S	propyl	OCOEt	4-fluoro-1-naphthyl
S	propyl	OCOEt	5-chloro-2-thienyl
S	propyl	OCOEt	4-methyl-1-naphthyl
S	propyl	OCOEt	1-methyl-2-pyrrolyl
S	propyl	OCOEt	2-methyl-3-furyl
S	propyl	OCOEt	5-methyl-2-thienyl
S	propyl	OCOEt	4-methyl-5-imidazolyl
S	propyl	OCOEt	1-methyl-3-indolyl
S	propyl	OCOEt	2-methoxy-1-naphthyl
S	propyl	OCOEt	3-methoxy-2-naphthyl
S	propyl	OCOEt	6-ethoxy-2-naphthyl
S	propyl	OCOEt	5-methoxy-3-indolyl
S	propyl	OCOEt	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
S	propyl	OCOEt	5,6-dimethoxy-2-indolyl
S	propyl	OCOEt	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	n-butyl	OH	1-naphthyl
S	n-butyl	OH	2-naphthyl
S	n-butyl	OH	2-pyrrolyl
S	n-butyl	OH	3-pyrrolyl
S	n-butyl	OH	2-furyl
S	n-butyl	OH	3-furyl
S	n-butyl	OH	2-thienyl
S	n-butyl	OH	3-thienyl
S	n-butyl	OH	3-pyrazolyl
S	n-butyl	OH	4-pyrazolyl
S	n-butyl	OH	2-imidazolyl
S	n-butyl	OH	4-imidazolyl
S	n-butyl	OH	2-oxazolyl
S	n-butyl	OH	4-oxazolyl
S	n-butyl	OH	5-oxazolyl
S	n-butyl	OH	2-thiazolyl
S	n-butyl	OH	4-thiazolyl
S	n-butyl	OH	5-thiazolyl
S	n-butyl	OH	2-pyrimidinyl
S	n-butyl	OH	4-pyrimidinyl
S	n-butyl	OH	5-pyrimidinyl
S	n-butyl	OH	2-indolyl
S	n-butyl	OH	3-indolyl
S	n-butyl	OH	5-indolyl
S	n-butyl	OH	6-indolyl
S	n-butyl	OH	5-benzimidazolyl
S	n-butyl	OH	2-benzofuryl
S	n-butyl	OH	3-indazolyl
S	n-butyl	OH	2-benzoxazolyl
S	n-butyl	OH	4-fluoro-1-naphthyl
S	n-butyl	OH	5-chloro-2-thienyl
S	n-butyl	OH	4-methyl-1-naphthyl
S	n-butyl	OH	1-methyl-2-pyrrolyl
S	n-butyl	OH	2-methyl-3-furyl
S	n-butyl	OH	5-methyl-2-thienyl
S	n-butyl	OH	4-methyl-5-imidazolyl
S	n-butyl	OH	1-methyl-3-indolyl
S	n-butyl	OH	2-methoxy-1-naphthyl
S	n-butyl	OH	3-methoxy-2-naphthyl
S	n-butyl	OH	6-ethoxy-2-naphthyl
S	n-butyl	OH	5-methoxy-3-indolyl
S	n-butyl	OH	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
S	n-butyl	OH	5,6-dimethoxy-2-indolyl
S	n-butyl	OH	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	n-butyl	OCOOMe	1-naphthyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-naphthyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-pyrrolyl
S	n-butyl	OCOOMe	3-pyrrolyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-furyl
S	n-butyl	OCOOMe	3-furyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-thienyl
S	n-butyl	OCOOMe	3-thienyl
S	n-butyl	OCOOMe	3-pyrazolyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-pyrazolyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-imidazolyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-imidazolyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-oxazolyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-oxazolyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-oxazolyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-thiazolyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-thiazolyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-thiazolyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-pyrimidinyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-pyrimidinyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-pyrimidinyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-indolyl
S	n-butyl	OCOOMe	3-indolyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-indolyl
S	n-butyl	OCOOMe	6-indolyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-benzimidazolyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-benzofuryl
S	n-butyl	OCOOMe	3-indazolyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-benzoxazolyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-fluoro-1-naphthyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-chloro-2-thienyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-methyl-1-naphthyl
S	n-butyl	OCOOMe	1-methyl-2-pyrrolyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-methyl-3-furyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-methyl-2-thienyl
S	n-butyl	OCOOMe	4-methyl-5-imidazolyl
S	n-butyl	OCOOMe	1-methyl-3-indolyl
S	n-butyl	OCOOMe	2-methoxy-1-naphthyl
S	n-butyl	OCOOMe	3-methoxy-2-naphthyl
S	n-butyl	OCOOMe	6-ethoxy-2-naphthyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-methoxy-3-indolyl
S	n-butyl	OCOOMe	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
S	n-butyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-2-indolyl
S	n-butyl	OCOOMe	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	n-butyl	OCOEt	1-naphthyl
S	n-butyl	OCOEt	2-naphthyl
S	n-butyl	OCOEt	2-pyrrolyl
S	n-butyl	OCOEt	3-pyrrolyl
S	n-butyl	OCOEt	2-furyl
S	n-butyl	OCOEt	3-furyl
S	n-butyl	OCOEt	2-thienyl
S	n-butyl	OCOEt	3-thienyl
S	n-butyl	OCOEt	3-pyrazolyl
S	n-butyl	OCOEt	4-pyrazolyl
S	n-butyl	OCOEt	2-imidazolyl
S	n-butyl	OCOEt	4-imidazolyl
S	n-butyl	OCOEt	2-oxazolyl
S	n-butyl	OCOEt	4-oxazolyl
S	n-butyl	OCOEt	5-oxazolyl
S	n-butyl	OCOEt	2-thiazolyl
S	n-butyl	OCOEt	4-thiazolyl
S	n-butyl	OCOEt	5-thiazolyl
S	n-butyl	OCOEt	2-pyrimidinyl
S	n-butyl	OCOEt	4-pyrimidinyl
S	n-butyl	OCOEt	5-pyrimidinyl
S	n-butyl	OCOEt	2-indolyl
S	n-butyl	OCOEt	3-indolyl
S	n-butyl	OCOEt	5-indolyl
S	n-butyl	OCOEt	6-indolyl
S	n-butyl	OCOEt	5-benzimidazolyl
S	n-butyl	OCOEt	2-benzofuryl
S	n-butyl	OCOEt	3-indazolyl
S	n-butyl	OCOEt	2-benzoxazolyl
S	n-butyl	OCOEt	4-fluoro-1-naphthyl
S	n-butyl	OCOEt	5-chloro-2-thienyl
S	n-butyl	OCOEt	4-methyl-1-naphthyl
S	n-butyl	OCOEt	1-methyl-2-pyrrolyl
S	n-butyl	OCOEt	2-methyl-3-furyl
S	n-butyl	OCOEt	5-methyl-2-thienyl
S	n-butyl	OCOEt	4-methyl-5-imidazolyl
S	n-butyl	OCOEt	1-methyl-3-indolyl
S	n-butyl	OCOEt	2-methoxy-1-naphthyl
S	n-butyl	OCOEt	3-methoxy-2-naphthyl
S	n-butyl	OCOEt	6-ethoxy-2-naphthyl
S	n-butyl	OCOEt	5-methoxy-3-indolyl
S	n-butyl	OCOEt	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
S	n-butyl	OCOEt	5,6-dimethoxy-2-indolyl
S	n-butyl	OCOEt	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	n-pentyl	OH	1-naphthyl
S	n-pentyl	OH	2-naphthyl
S	n-pentyl	OH	2-pyrrolyl
S	n-pentyl	OH	3-pyrrolyl
S	n-pentyl	OH	2-furyl
S	n-pentyl	OH	3-furyl
S	n-pentyl	OH	2-thienyl
S	n-pentyl	OH	3-thienyl
S	n-pentyl	OH	3-pyrazolyl
S	n-pentyl	OH	4-pyrazolyl
S	n-pentyl	OH	2-imidazolyl
S	n-pentyl	OH	4-imidazolyl
S	n-pentyl	OH	2-oxazolyl
S	n-pentyl	OH	4-oxazolyl
S	n-pentyl	OH	5-oxazolyl
S	n-pentyl	OH	2-thiazolyl
S	n-pentyl	OH	4-thiazolyl
S	n-pentyl	OH	5-thiazolyl
S	n-pentyl	OH	2-pyrimidinyl
S	n-pentyl	OH	4-pyrimidinyl
S	n-pentyl	OH	5-pyrimidinyl
S	n-pentyl	OH	2-indolyl
S	n-pentyl	OH	3-indolyl
S	n-pentyl	OH	5-indolyl
S	n-pentyl	OH	6-indolyl
S	n-pentyl	OH	5-benzimidazolyl
S	n-pentyl	OH	2-benzofuryl
S	n-pentyl	OH	3-indazolyl
S	n-pentyl	OH	2-benzoxazolyl
S	n-pentyl	OH	4-fluoro-1-naphthyl
S	n-pentyl	OH	5-chloro-2-thienyl
S	n-pentyl	OH	4-methyl-1-naphthyl
S	n-pentyl	OH	1-methyl-2-pyrrolyl
S	n-pentyl	OH	2-methyl-3-furyl
S	n-pentyl	OH	5-methyl-2-thienyl
S	n-pentyl	OH	4-methyl-5-imidazolyl
S	n-pentyl	OH	1-methyl-3-indolyl
S	n-pentyl	OH	2-methoxy-1-naphthyl
S	n-pentyl	OH	3-methoxy-2-naphthyl
S	n-pentyl	OH	6-ethoxy-2-naphthyl
S	n-pentyl	OH	5-methoxy-3-indolyl
S	n-pentyl	OH	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
S	n-pentyl	OH	5,6-dimethoxy-2-indolyl
S	n-pentyl	OH	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	n-pentyl	OCOOMe	1-naphthyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-naphthyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-pyrrolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	3-pyrrolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-furyl
S	n-pentyl	OCOOMe	3-furyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-thienyl
S	n-pentyl	OCOOMe	3-thienyl
S	n-pentyl	OCOOMe	3-pyrazolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-pyrazolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-imidazolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-imidazolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-oxazolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-oxazolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-oxazolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-thiazolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-thiazolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-thiazolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-pyrimidinyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-pyrimidinyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-pyrimidinyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-indolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	3-indolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-indolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	6-indolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-benzimidazolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-benzofuryl
S	n-pentyl	OCOOMe	3-indazolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-benzoxazolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-fluoro-1-naphthyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-chloro-2-thienyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-methyl-1-naphthyl
S	n-pentyl	OCOOMe	1-methyl-2-pyrrolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-methyl-3-furyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-methyl-2-thienyl
S	n-pentyl	OCOOMe	4-methyl-5-imidazolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	1-methyl-3-indolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	2-methoxy-1-naphthyl
S	n-pentyl	OCOOMe	3-methoxy-2-naphthyl
S	n-pentyl	OCOOMe	6-ethoxy-2-naphthyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-methoxy-3-indolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5,6-dimethoxy-2-indolyl
S	n-pentyl	OCOOMe	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40



X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	n-pentyl	OCOEt	1-naphthyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-naphthyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-pyrrolyl
S	n-pentyl	OCOEt	3-pyrrolyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-furyl
S	n-pentyl	OCOEt	3-furyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-thienyl
S	n-pentyl	OCOEt	3-thienyl
S	n-pentyl	OCOEt	3-pyrazolyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-pyrazolyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-imidazolyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-imidazolyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-oxazolyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-oxazolyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-oxazolyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-thiazolyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-thiazolyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-thiazolyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-pyrimidinyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-pyrimidinyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-pyrimidinyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-indolyl
S	n-pentyl	OCOEt	3-indolyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-indolyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-indolyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-benzimidazolyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-benzofuryl
S	n-pentyl	OCOEt	3-indazolyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-benzoxazolyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-fluoro-1-naphthyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-chloro-2-thienyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-methyl-1-naphthyl
S	n-pentyl	OCOEt	1-methyl-2-pyrrolyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-methyl-3-furyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-methyl-2-thienyl
S	n-pentyl	OCOEt	4-methyl-5-imidazolyl
S	n-pentyl	OCOEt	1-methyl-3-indolyl
S	n-pentyl	OCOEt	2-methoxy-1-naphthyl
S	n-pentyl	OCOEt	3-methoxy-2-naphthyl
S	n-pentyl	OCOEt	6-ethoxy-2-naphthyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-methoxy-3-indolyl
S	n-pentyl	OCOEt	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
S	n-pentyl	OCOEt	5,6-dimethoxy-2-indolyl
S	n-pentyl	OCOEt	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	2-methoxyethyl	OH	1-naphthyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-naphthyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-pyrrolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	3-pyrrolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-furyl
NH	2-methoxyethyl	OH	3-furyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-thienyl
NH	2-methoxyethyl	OH	3-thienyl
NH	2-methoxyethyl	OH	3-pyrazolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	4-pyrazolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-imidazolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	4-imidazolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-oxazolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	4-oxazolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	5-oxazolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-thiazolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	4-thiazolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	5-thiazolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-pyrimidinyl
NH	2-methoxyethyl	OH	4-pyrimidinyl
NH	2-methoxyethyl	OH	5-pyrimidinyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-indolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	3-indolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	5-indolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	6-indolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	5-benzimidazolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-benzofuryl
NH	2-methoxyethyl	OH	3-indazolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-benzoxazolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	4-fluoro-1-naphthyl
NH	2-methoxyethyl	OH	5-chloro-2-thienyl
NH	2-methoxyethyl	OH	4-methyl-1-naphthyl
NH	2-methoxyethyl	OH	1-methyl-2-pyrrolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-methyl-3-furyl
NH	2-methoxyethyl	OH	5-methyl-2-thienyl
NH	2-methoxyethyl	OH	4-methyl-5-imidazolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	1-methyl-3-indolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	2-methoxy-1-naphthyl
NH	2-methoxyethyl	OH	3-methoxy-2-naphthyl
NH	2-methoxyethyl	OH	6-methoxy-2-naphthyl
NH	2-methoxyethyl	OH	5-methoxy-3-indolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
NH	2-methoxyethyl	OH	5,6-dimethoxy-2-indolyl
NH	2-methoxyethyl	OH	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
NH	3-methoxypropyl	OH	1-naphthyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-naphthyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-pyrrolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	3-pyrrolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-furyl
NH	3-methoxypropyl	OH	3-furyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-thienyl
NH	3-methoxypropyl	OH	3-thienyl
NH	3-methoxypropyl	OH	3-pyrazolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	4-pyrazolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-imidazolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	4-imidazolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-oxazolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	4-oxazolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	5-oxazolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-thiazolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	4-thiazolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	5-thiazolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-pyrimidinyl
NH	3-methoxypropyl	OH	4-pyrimidinyl
NH	3-methoxypropyl	OH	5-pyrimidinyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-indolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	3-indolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	5-indolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	6-indolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	5-benzimidazolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-benzofuryl
NH	3-methoxypropyl	OH	3-indazolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-benzoxazolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	4-fluoro-1-naphthyl
NH	3-methoxypropyl	OH	5-chloro-2-thienyl
NH	3-methoxypropyl	OH	4-methyl-1-naphthyl
NH	3-methoxypropyl	OH	1-methyl-2-pyrrolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-methyl-3-furyl
NH	3-methoxypropyl	OH	5-methyl-2-thienyl
NH	3-methoxypropyl	OH	4-methyl-5-imidazolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	1-methyl-3-indolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	2-methoxy-1-naphthyl
NH	3-methoxypropyl	OH	3-methoxy-2-naphthyl
NH	3-methoxypropyl	OH	6-ethoxy-2-naphthyl
NH	3-methoxypropyl	OH	5-methoxy-3-indolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
NH	3-methoxypropyl	OH	5,6-dimethoxy-2-indolyl
NH	3-methoxypropyl	OH	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
○	2-methoxyethyl	OH	1-naphthyl
○	2-methoxyethyl	OH	2-naphthyl
○	2-methoxyethyl	OH	2-pyrrolyl
○	2-methoxyethyl	OH	3-pyrrolyl
○	2-methoxyethyl	OH	2-furyl
○	2-methoxyethyl	OH	3-furyl
○	2-methoxyethyl	OH	2-thienyl
○	2-methoxyethyl	OH	3-thienyl
○	2-methoxyethyl	OH	3-pyrazolyl
○	2-methoxyethyl	OH	4-pyrazolyl
○	2-methoxyethyl	OH	2-imidazolyl
○	2-methoxyethyl	OH	4-imidazolyl
○	2-methoxyethyl	OH	2-oxazolyl
○	2-methoxyethyl	OH	4-oxazolyl
○	2-methoxyethyl	OH	5-oxazolyl
○	2-methoxyethyl	OH	2-thiazolyl
○	2-methoxyethyl	OH	4-thiazolyl
○	2-methoxyethyl	OH	5-thiazolyl
○	2-methoxyethyl	OH	2-pyrimidinyl
○	2-methoxyethyl	OH	4-pyrimidinyl
○	2-methoxyethyl	OH	5-pyrimidinyl
○	2-methoxyethyl	OH	2-indolyl
○	2-methoxyethyl	OH	3-indolyl
○	2-methoxyethyl	OH	5-indolyl
○	2-methoxyethyl	OH	6-indolyl
○	2-methoxyethyl	OH	5-benzimidazolyl
○	2-methoxyethyl	OH	2-benzofuryl
○	2-methoxyethyl	OH	3-indazolyl
○	2-methoxyethyl	OH	2-benzoxazolyl
○	2-methoxyethyl	OH	4-fluoro-1-naphthyl
○	2-methoxyethyl	OH	5-chloro-2-thienyl
○	2-methoxyethyl	OH	4-methyl-1-naphthyl
○	2-methoxyethyl	OH	1-methyl-2-pyrrolyl
○	2-methoxyethyl	OH	2-methyl-3-furyl
○	2-methoxyethyl	OH	5-methyl-2-thienyl
○	2-methoxyethyl	OH	4-methyl-5-imidazolyl
○	2-methoxyethyl	OH	1-methyl-3-indolyl
○	2-methoxyethyl	OH	2-methoxy-1-naphthyl
○	2-methoxyethyl	OH	3-methoxy-2-naphthyl
○	2-methoxyethyl	OH	6-methoxy-2-naphthyl
○	2-methoxyethyl	OH	5-methoxy-3-indolyl
○	2-methoxyethyl	OH	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
○	2-methoxyethyl	OH	5,6-dimethoxy-2-indolyl
○	2-methoxyethyl	OH	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
○	3-methoxypropyl	OH	1-naphthyl
○	3-methoxypropyl	OH	2-naphthyl
○	3-methoxypropyl	OH	2-pyrrolyl
○	3-methoxypropyl	OH	3-pyrrolyl
○	3-methoxypropyl	OH	2-furyl
○	3-methoxypropyl	OH	3-furyl
○	3-methoxypropyl	OH	2-thienyl
○	3-methoxypropyl	OH	3-thienyl
○	3-methoxypropyl	OH	3-pyrazolyl
○	3-methoxypropyl	OH	4-pyrazolyl
○	3-methoxypropyl	OH	2-imidazolyl
○	3-methoxypropyl	OH	4-imidazolyl
○	3-methoxypropyl	OH	2-oxazolyl
○	3-methoxypropyl	OH	4-oxazolyl
○	3-methoxypropyl	OH	5-oxazolyl
○	3-methoxypropyl	OH	2-thiazolyl
○	3-methoxypropyl	OH	4-thiazolyl
○	3-methoxypropyl	OH	5-thiazolyl
○	3-methoxypropyl	OH	2-pyrimidinyl
○	3-methoxypropyl	OH	4-pyrimidinyl
○	3-methoxypropyl	OH	5-pyrimidinyl
○	3-methoxypropyl	OH	2-indolyl
○	3-methoxypropyl	OH	3-indolyl
○	3-methoxypropyl	OH	5-indolyl
○	3-methoxypropyl	OH	6-indolyl
○	3-methoxypropyl	OH	5-benzimidazolyl
○	3-methoxypropyl	OH	2-benzofuryl
○	3-methoxypropyl	OH	3-indazolyl
○	3-methoxypropyl	OH	2-benzoxazolyl
○	3-methoxypropyl	OH	4-fluoro-1-naphthyl
○	3-methoxypropyl	OH	5-chloro-2-thienyl
○	3-methoxypropyl	OH	4-methyl-1-naphthyl
○	3-methoxypropyl	OH	1-methyl-2-pyrrolyl
○	3-methoxypropyl	OH	2-methyl-3-furyl
○	3-methoxypropyl	OH	5-methyl-2-thienyl
○	3-methoxypropyl	OH	4-methyl-5-imidazolyl
○	3-methoxypropyl	OH	1-methyl-3-indolyl
○	3-methoxypropyl	OH	2-methoxy-1-naphthyl
○	3-methoxypropyl	OH	3-methoxy-2-naphthyl
○	3-methoxypropyl	OH	6-methoxy-2-naphthyl
○	3-methoxypropyl	OH	5-methoxy-3-indolyl
○	3-methoxypropyl	OH	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
○	3-methoxypropyl	OH	5,6-dimethoxy-2-indolyl
○	3-methoxypropyl	OH	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	2-methoxyethyl	OH	1-naphthyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-naphthyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-pyrrolyl
S	2-methoxyethyl	OH	3-pyrrolyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-furyl
S	2-methoxyethyl	OH	3-furyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-thienyl
S	2-methoxyethyl	OH	3-thienyl
S	2-methoxyethyl	OH	3-pyrazolyl
S	2-methoxyethyl	OH	4-pyrazolyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-imidazolyl
S	2-methoxyethyl	OH	4-imidazolyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-oxazolyl
S	2-methoxyethyl	OH	4-oxazolyl
S	2-methoxyethyl	OH	5-oxazolyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-thiazolyl
S	2-methoxyethyl	OH	4-thiazolyl
S	2-methoxyethyl	OH	5-thiazolyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-pyrimidinyl
S	2-methoxyethyl	OH	4-pyrimidinyl
S	2-methoxyethyl	OH	5-pyrimidinyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-indolyl
S	2-methoxyethyl	OH	3-indolyl
S	2-methoxyethyl	OH	5-indolyl
S	2-methoxyethyl	OH	6-indolyl
S	2-methoxyethyl	OH	5-benzimidazolyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-benzofuryl
S	2-methoxyethyl	OH	3-indazolyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-benzoxazolyl
S	2-methoxyethyl	OH	4-fluoro-1-naphthyl
S	2-methoxyethyl	OH	5-chloro-2-thienyl
S	2-methoxyethyl	OH	4-methyl-1-naphthyl
S	2-methoxyethyl	OH	1-methyl-2-pyrrolyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-methyl-3-furyl
S	2-methoxyethyl	OH	5-methyl-2-thienyl
S	2-methoxyethyl	OH	4-methyl-5-imidazolyl
S	2-methoxyethyl	OH	1-methyl-3-indolyl
S	2-methoxyethyl	OH	2-methoxy-1-naphthyl
S	2-methoxyethyl	OH	3-methoxy-2-naphthyl
S	2-methoxyethyl	OH	6-ethoxy-2-naphthyl
S	2-methoxyethyl	OH	5-methoxy-3-indolyl
S	2-methoxyethyl	OH	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
S	2-methoxyethyl	OH	5,6-dimethoxy-2-indolyl
S	2-methoxyethyl	OH	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl
X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y

10

20

30

40

X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y
S	2-hydroxyethyl	OH	1-naphthyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-naphthyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-pyrrolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	3-pyrrolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-furyl
S	2-hydroxyethyl	OH	3-furyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-thienyl
S	2-hydroxyethyl	OH	3-thienyl
S	2-hydroxyethyl	OH	3-pyrazolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	4-pyrazolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-imidazolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	4-imidazolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-oxazolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	4-oxazolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	5-oxazolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-thiazolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	4-thiazolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	5-thiazolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-pyrimidinyl
S	2-hydroxyethyl	OH	4-pyrimidinyl
S	2-hydroxyethyl	OH	5-pyrimidinyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-indolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	3-indolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	5-indolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	6-indolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	5-benzimidazolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-benzofuryl
S	2-hydroxyethyl	OH	3-indazolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-benzoxazolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	4-fluoro-1-naphthyl
S	2-hydroxyethyl	OH	5-chloro-2-thienyl
S	2-hydroxyethyl	OH	4-methyl-1-naphthyl
S	2-hydroxyethyl	OH	1-methyl-2-pyrrolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-methyl-3-furyl
S	2-hydroxyethyl	OH	5-methyl-2-thienyl
S	2-hydroxyethyl	OH	4-methyl-5-imidazolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	1-methyl-3-indolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	2-methoxy-1-naphthyl
S	2-hydroxyethyl	OH	3-methoxy-2-naphthyl
S	2-hydroxyethyl	OH	6-ethoxy-2-naphthyl
S	2-hydroxyethyl	OH	5-methoxy-3-indolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	1,4-dimethoxy-2-naphthyl
S	2-hydroxyethyl	OH	5,6-dimethoxy-2-indolyl
S	2-hydroxyethyl	OH	5-methoxy-1-methyl-2-indolyl

10

20

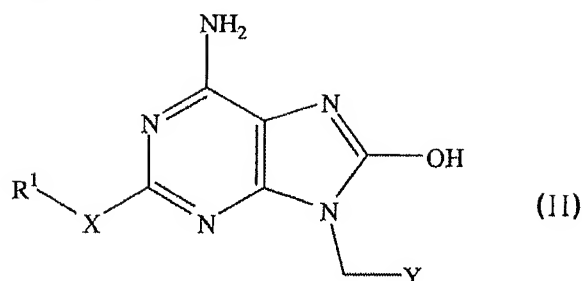
30

40

## 【0016】

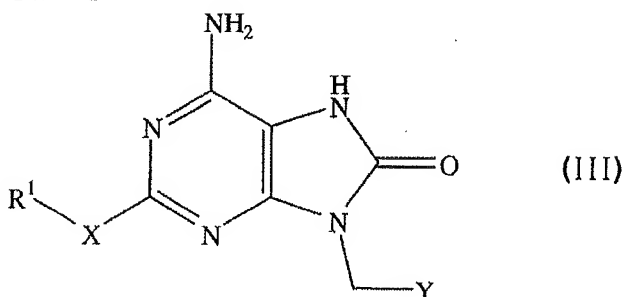
本発明の化合物において、R<sup>2</sup> がアシルオキシ基又はアルコキシカルボニルオキシ基である化合物は、R<sup>2</sup> が水酸基である化合物のエステルに相当し、R<sup>2</sup> が水酸基である化合物の溶解性、吸収性、体内安定性の向上を目的としたプロドラッグである。即ち、該エステルの生体内で代謝を受け、活性本体であるR<sup>2</sup> が水酸基である化合物となる。一般式（I）で示される化合物とその互変異性体は化学的に等価であり、本発明のアデニン誘導体はその互変異性体も含む。例えば、R<sup>2</sup> が水酸基の場合、一般式（I）で示される化合物は一般式（I I）：

## 【化 3】



(式中、 $R^1$ 、 $X$ 、 $Y$ は前記式(Ⅰ)と同義である)のヒドロキシ誘導体となるが、該誘導体の互変異性体として下記一般式(Ⅲ)：

## 【化 4】



(式中、 $R^1$ 、 $X$ 、 $Y$ は前記式(Ⅰ)と同義である)のオキソ誘導体がある。  
これらのアデニン誘導体の製法の一例を以下に詳述する。

## 【0017】

(1)  $R^2 = OH$ の場合

化合物(Ⅳ)と $Y-CH_2-Hal$ (式中、 $Y$ は式(Ⅰ)と同義で、 $Hal$ はハロゲン原子を表す。)とを塩基存在下に反応させて9-置換体(Ⅴ)を合成する。前記塩基としては、例えば炭酸カリウム等の炭酸のアルカリ金属塩又はアルカリ土類金属塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の金属水酸化物、水素化ナトリウム等の金属水素化物、 $t$ -ブトキシカリウム等のアルコキシド等を用いることができる。前記溶媒としてはジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等の非プロトン性溶媒を用いることができ、反応温度は室温から溶媒の還流温度までの間で行うことができる。

次いで、 $X$ が $NH$ の場合は、化合物(Ⅴ)と対応する $R^1-NH_2$ (式中、 $R^1$ は前記と同義である)とを塩基の存在下または非存在下に反応させて2-置換体(Ⅵ)を合成する。塩基としてはトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、4-ジメチルアミノピリジンなどの3級アミン類、溶媒としてはテトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、ジグライムなどの非プロトン性溶媒やプロパノール、ブタノールなどのアルコール系溶媒を用いることができ、あるいは無溶媒で行ってもよい。反応温度は50℃から溶媒の還流温度までの間で行うことができる。

$X$ が酸素原子または硫黄原子の場合は、化合物(Ⅴ)と対応する $R^1-OH$ または $R^1-SH$ とを塩基の存在下に反応させて2-置換体(Ⅵ)を合成する。塩基としてはナトリウム、カリウム等のアルカリ金属、水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物等を用いることができ、溶媒としてはジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、ジグライムなどの非プロトン性溶媒を用いるか、あるいは無溶媒で行うこともできる。反応温度は50℃から溶媒の還流温度までの間で行うことができる。

なお、化合物(Ⅳ)から化合物(Ⅵ)を製造する工程において、最初に2-置換体(Ⅵ')を合成し、次いで、該2-置換体(Ⅵ')と $Y-CH_2-Hal$ (式中、 $Y$ は式(Ⅰ)と同義である)とを塩基存在下に反応させて9-置換体(Ⅴ)を合成する。

10

20

30

40

50

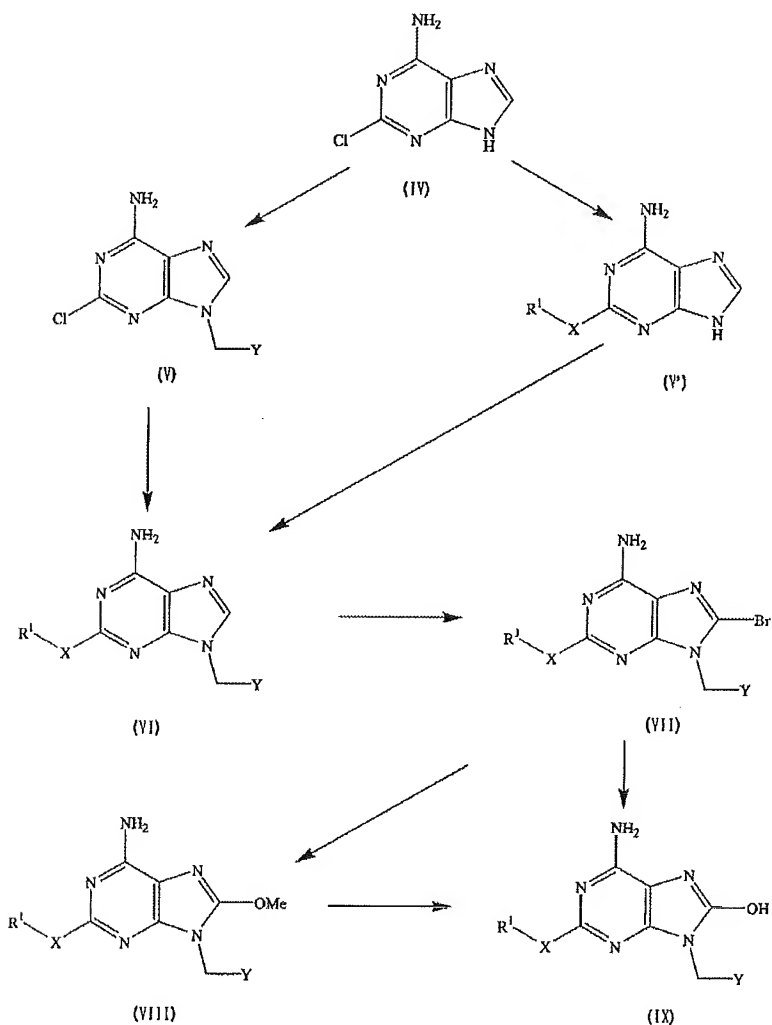


(I I)と同義で、H a lはハロゲン原子を表す。)とを反応させて化合物(V I)を得ることができる。化合物(V I I)は、化合物(V I)と臭素とを反応させて合成することができる。溶媒としては四塩化炭素、ジクロロメタン、クロロホルムなどのハロゲン系溶媒、酢酸などを用いることができる。反応温度は0℃から溶媒の還流温度までの間で行うことができる。また、反応においては酢酸ナトリウムなどの反応助剤を加えてもよい。

【0018】

化合物(I X)は、化合物(V I I)を酸性条件下で加水分解することにより合成することができる。酸としては塩酸、臭化水素酸などを用いることができる。反応温度は50℃から溶媒の還流温度までの間で行うことができる。あるいは、化合物(V I I)とナトリウムメトキシドとを反応させて化合物(V I I I)とした後に、酸処理して脱メチル化することにより(I X)を得ることもできる。

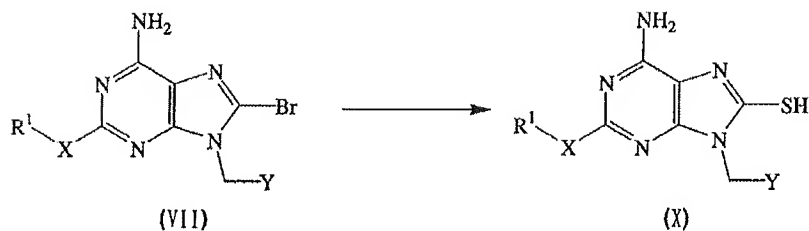
【化5】



化合物(X)は、化合物(V I I)に水硫化ナトリウム(硫化水素ナトリウム)を反応させて合成することができる。溶媒はエタノール、プロパノール、ブタノールなどのアルコール系溶媒を用いることができる。反応温度は50℃から溶媒の還流温度までの間で行うことができる。

【0019】

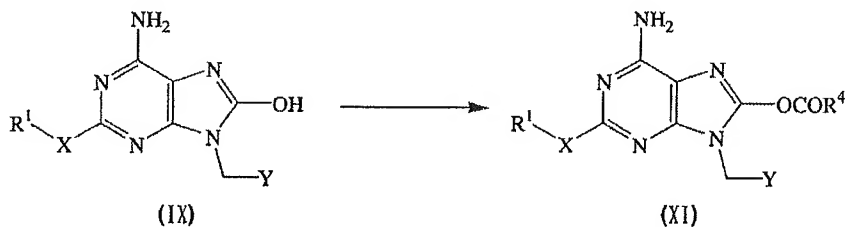
【化6】



化合物 (X I) は、化合物 (I X) を塩基存在下、 $R^2$  に対応するアシルクロリドあるいはクロロギ酸エステルと反応させることにより得ることができる。塩基としてはトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、4-ジメチルアミノピリジンなどの3級アミン類、溶媒としてはテトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、ジクロロメタンなどの非プロトン性溶媒を用いることができる。反応温度は0℃から溶媒の還流温度までの間で行うことができる（式中、 $R^4$  は炭素数1～7のアルキル基または炭素数1～7のアルコキシ基を表す。）。

【0020】

【化7】



以上のようにして得られる本発明のアデニン誘導体は、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、塩酸塩、臭化水素酸塩、硫酸塩、硝酸塩、酢酸塩、メタンスルホン酸塩、トルエンスルホン酸塩、クエン酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩などの薬学的に許容される塩としても用いることもできる。

【0021】

本発明のアデニン誘導体は、B型及びC型肝炎、エイズなどのウイルス疾患、癌疾患及びタイプ2ヘルパーT細胞を起因とする疾患等の治療薬として有用であり、錠剤、カプセル剤、散剤などの経口剤をはじめ、注射剤、外用剤など種々の剤形で使用することができる。本発明の医薬としては、一般式(1)で表される化合物、その互変異性体、及びそれらの薬学的に許容される塩からなる群から選ばれる物質を用いることができ、さらにそれらの水和物、または溶媒和物を用いてもよい。これらの物質の2以上を適宜組み合わせ用いてもよい。これらの群から選ばれる物質自体を本発明の医薬として投与してもよいが、通常は、有効成分である上記物質と薬学的に許容される製剤用添加物とを含む医薬組成物の形態で投与することが望ましい。

【0022】

生体内に適用するための医薬組成物は、有効成分である上記物質を薬学的に許容される製剤用添加物の1種または2種以上と混合し、薬学の分野において汎用の製剤方法に従って容易に製造することができる。本発明の医薬の投与経路は特に限定されないが、治療および/または予防に際して最も効果的な経路を適宜選択することが望ましい。経口投与に適する医薬組成物としては、例えば、カプセル剤、散剤、錠剤、顆粒剤、細粒剤、シロップ剤、液剤、懸濁剤などを挙げることができ、非経口的に適する医薬組成物としては、例えば、吸入剤、噴霧剤、直腸内投与剤、注射剤、点滴剤、軟膏、クリーム剤、経皮吸収剤、経粘膜吸収剤、点眼剤、点鼻剤、点耳剤、テープ剤、貼付剤などを挙げることができるが、本発明の医薬の形態はこれらに限定されることはない。

【0023】

10

20

30

40

50

経口投与に適当な医薬組成物のうち、例えば乳剤およびシロップ剤などの液体製剤は、水；ショ糖、ソルビット、果糖等の糖類；ポリエチレングリコール、プロピレングリコール等のグリコール類；ごま油、オリーブ油、大豆油等の油類；p-ヒドロキシ安息香酸エステル類等の防腐剤；ストロベリーフレーバー、ペパーミント等のフレーバー類などの製剤用添加物を用いて製造することができる。カプセル剤、錠剤、散剤、および顆粒剤などの固形製剤は、乳糖、ブドウ糖、ショ糖、マンニット等の賦形剤；デンプン、アルギン酸ソーダ等の崩壊剤；ステアリン酸マグネシウム、タルク等の滑沢剤；ポリビニルアルコール、ヒドロキシプロピルセルロース、ゼラチン等の結合剤；脂肪酸エステル等の界面活性剤；グリセリン等の可塑剤等を用いて製造することができる。

非経口投与に適する医薬組成物のうち、注射剤、点滴剤、点眼剤などの形態の液体製剤は、好ましくは滅菌された等張の液体製剤として調製することができる。例えば、注射剤は、塩溶液、ブドウ糖溶液、または塩水とブドウ糖溶液との混合物からなる水性媒体を用いて調製することができる。直腸内投与剤は、例えばカカオ脂、水素化脂肪、または水素化カルボン酸等の担体を用いて、通常は坐剤の形態として調製することができる。また、噴霧剤の調製には、有効成分である上記の物質を微細な粒子として分散させて吸収を容易にする非刺激性の担体を用いることができる。このような担体として、例えば、乳糖、グリセリン等を挙げることができ、製剤の形態としてはエアロゾルやドライパウダー等の形態を選択することが可能である。なお、非経口投与用の医薬組成物の製造においても、経口剤で例示した希釈剤、香料、防腐剤、賦形剤、崩壊剤、滑沢剤、結合剤、界面活性剤、可塑剤等から選択される1種または2種以上の製剤用添加物を適宜用いることができる。も

っとも、本発明の医薬の製造に用いられる製剤用添加物は上記のものに限定されることはなく、当業者に利用可能なものであればいかなるものを用いてもよい。本発明のアデニン誘導体の用量は、患者の性別、年齢、体重、疾患の種類、症状などに応じて適宜定めるものであるが、一般に、1日当たり0.001～100 mg/kgの範囲で、好ましくは0.01～10 mg/kgの範囲で、単回又は数回に分けて投与することができる。

【0024】

【実施例】

参考例1： 2-ブトキシアデニン

ブタノール（480 mL）にナトリウム（13.6 g, 0.59 mol）を加え、90℃まで昇温して完溶させた。続いて2-クロロアデニン（4.0 g, 23.6 mmol）を加え、9時間加熱還流した。4℃まで冷却した後、反応液に水（400 mL）を加え30分間、強く攪拌した。分層したブタノール層を減圧濃縮した後、残渣に水（400 mL）を加え、氷冷下濃塩酸を滴下して中和した。析出した固体を濾取し、得られた固体をエタノール（70 mL）に加え、30分間加熱還流した。室温まで冷却した後、析出した固体を濾取しすることで標記化合物を3.72 g得た（収率：76%）。

参考例2： 8-ブロモ-2-ブトキシ-9-（6-クロロ-3-ピリジルメチル）アデニン

参考例1で得られた2-ブトキシアデニン（2.60 g, 12.5 mmol）のDMF溶液（125 mL）に、炭酸カリウム（2.85 g, 20.6 mmol）と2-クロロ-5-クロロメチルピリジン（3.33 g, 20.6 mmol）を加え、80℃で2.5時間加熱攪拌した。反応液を減圧濃縮した後、水（100 mL）を加え1N塩酸で中和し、析出した固体を濾取した。この固体を塩化メチレン（100 mL）に溶解させた後、氷冷下ヘキサン（150 mL）を加え、析出した結晶を濾取することにより2-ブトキシ-9-（6-クロロ-3-ピリジルメチル）アデニンを得た（収量：3.12 g）。酢酸ナトリウム（3.05 g, 37.2 mmol）と2-ブトキシ-9-（6-クロロ-3-ピリジルメチル）アデニン（3.1 g, 9.31 mmol）を加えた酢酸懸濁液（186 mL）に、室温で臭素（1.92 mL, 37.5 mmol）を加え、4時間反応させた。反応液を減圧留去した後、残渣に水（

200 mL)を加え、氷冷下5N水酸化ナトリウムで中和した。析出した結晶を濾取した後、粗結晶をメタノールにて再結晶した。40℃で15時間減圧乾燥して、白色粉末結晶として標記化合物を2.38 g得た(収率: 62%)。

参考例3: 2-ブトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-メトキシアデニン

メタノール(110 mL)にナトリウム(614 mg, 26.7 mmol)を加え完溶させた。この溶液に参考例2で得られた8-ブromo-2-ブトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)アデニン(2.2 g, 5.34 mmol)を加え、3.5時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣に水(100 mL)を加え氷冷下、濃塩酸で中和した。析出した固体を濾取、水洗した(20 mL)。この固体を酢酸エチル(30 mL)で再結晶させることにより白色粉末結晶として標記化合物を1.26 g得た(収率: 65.0%)。

参考例4: 2-ブトキシ-9-(6-メトキシ-3-ピリジルメチル)アデニン

メタノール(18 mL)にナトリウム415 mg, 18.0 mmol)を加え完溶させた後、2-ブトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)アデニン(300 mg, 0.90 mmol)を加え24時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣に水(30 mL)を加え、氷冷下、濃塩酸で中和した。析出した固体を濾取した後、粗結晶をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し(塩化メチレン:メタノール 50:1)、標記化合物を148 mg得た(収率: 50%)。

参考例5: 2-ブチルアミノアデニン

オートクレーブ(200 mL)に2-クロロアデニン(6.0 g, 35.4 mmol)とブチルアミン(30 mL)を加え、130℃で150時間反応させた。反応液を減圧濃縮した後、残渣に水を注入し固体を析出させた。析出固体を塩化メチレン、メタノールで順次洗浄して、黄橙色粉末固体として標記化合物を2.08 g得た(収率: 30%)。

実施例1: 2-ブトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

濃塩酸(70 mL)に参考例3で得られた化合物(1.26 g, 3.47 mmol)を加え、室温で2時間反応させた。反応液を減圧濃縮した後、残渣に水(130 mL)を加え氷冷下、5N水酸化ナトリウム水溶液で中和した。析出した結晶を濾取・乾燥することにより白色粉末結晶として標記化合物を1.20 g得た(収率: 99%)。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ 10.14 (1H, brs), 8.40 (1H, d, J = 2.4 Hz), 7.76 (1H, dd, J = 2.4, 8.4 Hz), 7.49 (1H, d, J = 8.4 Hz), 6.55 (2H, brs), 4.91 (2H, s), 4.14 (2H, t, J = 6.5 Hz), 1.67-1.57 (2H, m), 1.44-1.30 (2H, m), 0.90 (3H, t, J = 7.3 Hz)。

実施例2: 2-ブトキシ-8-ヒドロキシ-9-(6-メトキシ-3-ピリジルメチル)アデニン

対応する出発物質を用いて実施例1と同様にして標記化合物を得た。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ 10.09 (1H, brs), 8.16 (1H, d, J = 2.4 Hz), 7.65 (1H, dd, J = 2.4, 8.4 Hz), 6.78 (1H, d, J = 8.4 Hz), 6.49 (2H, brs), 4.80 (2H, s), 4.15 (2H, t, J = 6.6 Hz), 3.81 (3H, s), 1.66-1.58 (2H, m), 1.42-1.34 (2H, m), 0.91 (3H, t, J = 7.3 Hz)。

実施例3: 2-ブトキシ-9-(6-エトキシ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

10

20

30

40

50

対応する出発物質を用いて実施例 1 と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.06 (1H, brs), 8.14 (1H, d,  $J$  = 2.4 Hz), 7.64 (1H, dd,  $J$  = 2.4, 8.6 Hz), 6.75 (1H, d,  $J$  = 8.6 Hz), 6.48 (2H, brs), 4.80 (2H, s), 4.26 (2H, q,  $J$  = 7.2 Hz), 4.15 (2H, t,  $J$  = 6.6 Hz), 1.68-1.58 (2H, m), 1.42-1.34 (2H, m), 1.28 (3H, t,  $J$  = 7.2 Hz), 0.91 (3H, t,  $J$  = 7.3 Hz).

実施例 4: 2-ブトキシ-9-(6-n-ブトキシ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン 10

対応する出発物質を用いて実施例 1 と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.25 (1H, brs), 8.13 (1H, d,  $J$  = 1.9 Hz), 7.63 (1H, dd,  $J$  = 1.9, 8.4 Hz), 6.75 (1H, d,  $J$  = 8.4 Hz), 6.53 (2H, brs), 4.79 (2H, s), 4.23-4.12 (4H, m), 1.68-1.60 (4H, m), 1.42-1.34 (4H, m), 0.94-0.88 (6H, m).

実施例 5: 2-ブトキシ-9-(2-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン 20

対応する出発物質を用いて実施例 1 と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.15 (1H, brs), 8.36-8.33 (1H, m), 7.52-7.50 (1H, m), 7.41-7.36 (1H, m), 6.53 (2H, brs), 4.94 (2H, s), 4.07 (2H, t,  $J$  = 6.6 Hz), 1.62-1.52 (2H, m), 1.37-1.23 (2H, m), 0.87 (3H, t,  $J$  = 7.3 Hz).

実施例 6: 2-ブトキシ-8-ヒドロキシ-9-(2-メトキシ-3-ピリジルメチル) アデニン

対応する出発物質を用いて実施例 1 と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.06 (1H, brs), 8.08-8.06 (1H, m), 7.21-7.19 (1H, m), 6.93-6.88 (1H, m), 6.47 (2H, brs), 4.80 (2H, s), 4.08 (2H, t,  $J$  = 6.5 Hz), 3.92 (3H, s), 1.60-1.53 (2H, m), 1.38-1.29 (2H, m), 0.87 (3H, t,  $J$  = 7.3 Hz).

実施例 7: 2-ブトキシ-9-(6-クロロ-5-メトキシ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

対応する出発物質を用いて実施例 1 と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.06 (1H, brs), 8.12 (1H, d,  $J$  = 1.9 Hz), 7.85 (1H, d,  $J$  = 1.9 Hz), 6.49 (2H, brs), 4.83 (2H, s), 4.16 (2H, t,  $J$  = 6.6 Hz), 3.91 (3H, s), 1.66-1.61 (2H, m), 1.42-1.34 (2H, m), 0.91 (3H, t,  $J$  = 7.3 Hz).

実施例 8: 2-ブトキシ-8-ヒドロキシ-9-(3-ピリジルメチル) アデニン

2-クロロアデニン (520 mg, 3 mmol) の DMF 溶液 (30 ml) に、炭酸カリウム (1.1 g, 8 mmol) と 3-クロロメチルピリジン・塩酸塩 (660 mg,

5 mmol) を加え、80℃で3時間加熱攪拌した。反応液を減圧濃縮した後、水を加

え析出した固体を濾取することにより 2-クロロ-9-(3-ピリジルメチル)アデニンを得た(収量: 759 mg)。ブタノール(50 ml)にナトリウム(750 mg, 30 mmol)を加え、90℃まで昇温して完溶させた。続いて 2-クロロ-9-(3-ピリジルメチル)アデニン(430 mg, 1.5 mmol)を加え、2時間加熱環流した。溶媒を減圧濃縮した後、残渣に水を加え、氷冷下に濃塩酸を滴下して中和した。塩化メチレンを加えて分液し、有機層を減圧濃縮した。残渣へ酢酸 30 ml を加えて溶解させた後、臭素(660 mg, 5.5 mmol)を加え、室温で一昼夜反応させた。反応液を減圧留去した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し(塩化メチレン: メタノール 10:1)、8-ブロモ-2-ブトキシ-9-(3-ピリジルメチル)アデニンを 310 mg 得た。引き続き、参考例 3 及び実施例 1 と同様の操作により標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.22 (1H, brs), 8.56 (1H, d,  $J$  = 1.9 Hz), 8.49-8.47 (1H, m), 7.71-7.67 (1H, m), 7.38-7.33 (1H, m), 6.54 (2H, brs), 4.90 (2H, s), 4.14 (2H, t,  $J$  = 6.6 Hz), 1.65-1.57 (2H, m), 1.41-1.33 (2H, m), 0.90 (3H, t,  $J$  = 7.3 Hz).

実施例 9: 2-ブトキシ-8-ヒドロキシ-9-(4-ピリジルメチル)アデニン

対応する出発物質を用いて実施例 1 と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.20 (1H, brs), 8.70-8.68 (2H, m), 7.29-7.27 (2H, m), 6.48 (2H, brs), 4.92 (2H, s), 4.16 (2H, t,  $J$  = 6.6 Hz), 1.63-1.55 (2H, m), 1.40-1.32 (2H, m), 0.89 (3H, t,  $J$  = 7.3 Hz).

実施例 10: 2-ブトキシ-9-(ピラジン-2-イルメチル)-8-メトキシアデニン

対応する出発物質を用いて実施例 1 と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.02 (1H, brs), 8.66 (1H, s), 8.56-8.53 (2H, m), 6.48 (2H, brs), 5.05 (2H, s), 4.06 (2H, t,  $J$  = 6.6 Hz), 1.59-1.51 (2H, m), 1.37-1.29 (2H, m), 0.87 (3H, t,  $J$  = 7.3 Hz).

実施例 11: 2-ブトキシ-9-(5,6-ジクロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

参考例 2 と同様にして得られた 2-n-ブトキシ-8-ブロモ-9-(5,6-ジクロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン(150 mg, 0.34 mmol)のブタノール(4 mL)懸濁液に濃塩酸(4 mL)を加え、70℃で9時間反応させた。反応液を減圧濃縮した後、氷冷下、残渣に水(30 mL)を加え、1N水酸化ナトリウム水溶液で中和した。析出した固体を濾取した後、粗結晶をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し(塩化メチレン: メタノール 25:1)、白色粉末結晶として標記化合物を 45 mg 得た(収率: 35%)。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.16 (1H, brs), 8.36 (1H, d,  $J$  = 1.9 Hz), 8.06 (1H, d,  $J$  = 1.9 Hz), 6.52 (2H, brs), 4.93 (2H, s), 4.13 (2H, t,  $J$  = 6.6 Hz), 1.64-1.58 (2H, m), 1.40-1.32 (2H, m), 0.90 (3H, t,  $J$  = 7.3 Hz).

実施例 12: 2-ブトキシ-9-(2,6-ジクロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

対応する出発物質を用いて実施例 11 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  10.12 (1H, brs), 7.66 (1H, d,  $J$  = 8.4 Hz), 7.52 (1H, d,  $J$  = 8.4 Hz), 6.52 (2H, brs), 4.92 (2H, s), 4.08 (2H, t,  $J$  = 6.6 Hz), 1.60–1.52 (2H, m), 1.37–1.29 (2H, m), 0.88 (3H, t,  $J$  = 7.4 Hz).

実施例 13: 2-ブトキシ-9-(6-ピペリジノ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

ピペリジン (3 mL) に実施例 1 で得られる化合物 (100 mg, 0.29 mmol) を加え、90℃で30時間反応させた。反応液を減圧濃縮した後、残渣に塩化メチレン (50 mL) を加え固体を析出させた。析出固体を濾取し、水洗することにより白色粉末固体として標記化合物を56 mg 得た (収率: 49%)。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  9.79 (1H, brs), 8.09 (1H, d,  $J$  = 2.4 Hz), 7.47 (1H, dd,  $J$  = 2.4, 8.6 Hz), 6.75 (1H, d,  $J$  = 8.6 Hz), 6.44 (2H, brs), 4.70 (2H, s), 4.17 (2H, t,  $J$  = 6.5 Hz), 3.48–3.44 (4H, m), 1.67–1.35 (10H, m), 0.92 (3H, t,  $J$  = 7.3 Hz).

実施例 14: 2-ブトキシ-9-(6-(1-ピロリジニル)-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

実施例 1 で得られる化合物とピロリジンを用いて、実施例 13 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  10.03 (1H, brs), 8.07 (1H, d,  $J$  = 2.4 Hz), 7.46 (1H, dd,  $J$  = 2.4, 8.6 Hz), 6.45 (2H, brs), 6.37 (1H, d,  $J$  = 8.6 Hz), 4.69 (2H, s), 4.16 (2H, t,  $J$  = 6.6 Hz), 3.33–3.29 (4H, m), 1.93–1.88 (4H, m), 1.67–1.59 (2H, m), 1.43–1.35 (2H, m), 0.92 (3H, t,  $J$  = 7.3 Hz).

実施例 15: 2-ブトキシ-9-(6-モルホリノ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

実施例 1 で得られる化合物とモルホリンを用いて、実施例 13 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  10.01 (1H, brs), 8.14 (1H, d,  $J$  = 2.4 Hz), 7.53 (1H, dd,  $J$  = 2.4, 8.6 Hz), 6.78 (1H, d,  $J$  = 8.6 Hz), 6.45 (2H, brs), 4.73 (2H, s), 4.16 (2H, t,  $J$  = 6.6 Hz), 3.66 (4H, t,  $J$  = 4.9 Hz), 3.38 (4H, t,  $J$  = 4.9 Hz), 1.67–1.61 (2H, m), 1.43–1.35 (2H, m), 0.92 (3H, t,  $J$  = 7.3 Hz).

実施例 16: 2-ブトキシ-9-(6-ジメチルアミノ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

実施例 1 で得られる化合物と40%ジメチルアミン水溶液を用いて、実施例 13 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  10.12 (1H, brs), 8.09 (1H, d,  $J$  = 2.4 Hz), 7.48 (1H, dd,  $J$  = 2.4, 8.9 Hz), 6.57 (1H, d,  $J$  = 8.9 Hz), 6.49 (2H, brs), 4.70 (2H, s), 4.16 (2H, t,  $J$  = 6.6 Hz), 2.97 (6H, s), 1.70–1.46 (2H, m).

, m), 1.43-1.33 (2H, m), 0.92 (3H, t, J = 7.3 Hz).

実施例 17: 2-ブチルアミノ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

参考例 5 で得られる化合物を用いて、実施例 11 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.10 (1H, brs), 8.56 (1H, d, J = 1.9 Hz), 8.49-8.47 (1H, m), 7.71-7.67 (1H, m), 7.38-7.33 (1H, m), 6.50 (2H, brs), 4.90 (2H, s), 4.14 (2H, t, J = 6.6 Hz), 1.67-1.57 (2H, m), 1.41-1.30 (2H, m), 0.90 (3H, t, J = 7.3 Hz).

実施例 18: 2-ブチルアミノ-9-(2-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

参考例 5 で得られる化合物を用いて、実施例 11 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.76 (1H, brs), 8.35-8.32 (1H, m), 7.47-7.36 (2H, m), 6.23 (1H, brt, J = 5.7 Hz), 6.07 (2H, s), 4.88 (2H, s), 3.13-3.05 (2H, m), 1.43-1.27 (2H, m), 1.24-1.16 (2H, m), 0.82 (3H, t, J = 7.3 Hz).

実施例 19: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(6-メトキシ-3-ピリジルメチル)アデニン

参考例 5 で得られる化合物を用いて、実施例 11 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.07 (1H, brs), 8.17 (1H, d, J = 2.4 Hz), 7.67 (1H, dd, J = 2.4, 8.4 Hz), 6.82-6.76 (2H, m), 6.60 (2H, brs), 4.78 (2H, s), 3.81 (3H, s), 3.25-3.17 (2H, m), 1.54-1.43 (2H, m), 1.38-1.25 (2H, m), 0.89 (3H, t, J = 7.3 Hz).

実施例 20: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(2-ピリジルメチル)アデニン

参考例 5 で得られる化合物を用いて、実施例 11 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.88 (1H, s), 8.56-8.54 (1H, m), 8.05-7.89 (3H, m), 7.46-7.41 (2H, m), 5.05 (3H, s), 3.19-3.14 (2H, m), 1.44-1.21 (4H, m), 0.81 (3H, t, J = 7.3 Hz).

実施例 21: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(3-ピリジルメチル)アデニン

参考例 5 で得られる化合物を用いて、実施例 11 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.78 (1H, brs), 8.55 (1H, d, J = 2.4 Hz), 8.47 (1H, dd, J = 1.9, 4.9 Hz), 7.68 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.34 (1H, dd, J = 4.9, 7.8 Hz), 6.21 (1H, brt, J = 5.5 Hz), 6.05 (2H, brs), 4.84 (2H, s), 3.20-3.12 (2H, m), 1.47-1.39 (2H, m), 1.32-1.24 (2H, m), 0.87 (3H, t, J = 7.3 Hz).

実施例 22: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(4-ピリジルメチル)アデニン



参考例 5 で得られる化合物を用いて、実施例 11 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  11.05 (1H, brs), 8.76 (2H, d,  $J$  = 8.7 Hz), 8.09–7.88 (3H, m), 7.73 (2H, d,  $J$  = 8.7 Hz), 5.09 (2H, s), 3.22–3.17 (2H, m), 1.47–1.32 (2H, m), 1.29–1.18 (2H, m), 0.82 (3H, t,  $J$  = 7.4 Hz).

実施例 23: 2-ブチルアミノ-9-(2,6-ジクロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

参考例 5 で得られる化合物を用いて、実施例 11 と同様の方法で標記化合物を得た。

10

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.82 (1H, brs), 7.61–7.51 (2H, m), 6.23 (1H, brt,  $J$  = 5.4 Hz), 6.08 (2H, s), 4.87 (2H, s), 3.12–3.05 (2H, m), 1.40–1.19 (4H, m), 0.82 (3H, t,  $J$  = 7.3 Hz).

実施例 24: 2-ブチルアミノ-9-(6-ジメチルアミノ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

実施例 17 で得られる化合物と 40%ジメチルアミン水溶液を用いて、実施例 13 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.61 (1H, brs), 8.10 (1H, d,  $J$  = 2.2 Hz), 7.49 (1H, dd,  $J$  = 2.2, 8.6 Hz), 6.56 (1H, d,  $J$  = 8.6 Hz), 6.18 (1H, brt,  $J$  = 5.7 Hz), 5.97 (2H, brs), 4.65 (2H, s), 3.22–3.15 (2H, m), 2.97 (6H, s), 1.53–1.42 (2H, m), 1.38–1.24 (2H, m), 0.89 (3H, t,  $J$  = 7.3 Hz).

20

実施例 25: 2-ブトキシ-8-ヒドロキシ-9-(6-メチル-3-ピリジルメチル)アデニン

対応する出発物質を用いて実施例 1 と同様にして標記化合物を得た。

30

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.95 (1H, s), 8.42 (1H, d,  $J$  = 2.2 Hz), 7.58 (1H, dd,  $J$  = 2.2, 8.1 Hz), 7.20 (1H, d,  $J$  = 8.1 Hz), 6.46 (2H, brs), 4.84 (2H, s), 4.14 (2H, t,  $J$  = 6.6 Hz), 2.41 (3H, s), 1.62 (2H, m), 1.37 (2H, m), 0.90 (3H, t,  $J$  = 7.3 Hz).

実施例 26: 2-ブトキシ-8-ヒドロキシ-9-(2-メチル-3-ピリジルメチル)アデニン

対応する出発物質を用いて実施例 1 と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.01 (1H, brs), 8.33 (1H, d,  $J$  = 3.1 Hz), 7.39 (1H, d,  $J$  = 6.4 Hz), 7.15 (1H, dd,  $J$  = 3.1, 6.4 Hz), 6.49 (2H, brs), 4.88 (2H, s), 4.10 (2H, t,  $J$  = 6.6 Hz), 2.59 (3H, s), 1.59 (2H, m), 1.34 (2H, m), 0.88 (3H, t,  $J$  = 7.3 Hz).

40

実施例 27: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(6-メチル-3-ピリジルメチル)アデニン

参考例 5 で得られる化合物を用いて、実施例 11 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.78 (1H, s), 8.42 (1H, d,  $J$  = 2.2 Hz), 7.57 (1H, dd,  $J$  = 2.2,

50

8.0 Hz), 7.19 (1H, d, J = 8.0 Hz), 6.22 (1H, t, J = 7.1 Hz), 6.09 (2H, brs), 4.78 (2H, s), 3.16 (2H, m), 2.41 (3H, s), 1.44 (2H, m), 1.28 (2H, m), 0.87 (3H, t, J = 9.6 Hz).

実施例 28: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(2-メチル-3-ピリジルメチル) アデニン

参考例 5 で得られる化合物を用いて、実施例 11 と同様の方法で標記化合物を得た。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ 9.70 (1H, s), 8.32 (1H, d, J = 3.1 Hz), 7.37 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.14 (1H, dd, J = 3.1, 7.7 Hz), 6.20 (1H, t, J = 6.4 Hz), 6.0 (2H, brs), 4.82 (2H, s), 3.12 (2H, m), 2.60 (3H, s), 1.39 (2H, m), 1.25 (2H, m), 0.84 (3H, t, J = 7.1 Hz).

実施例 29: 2-ブチルアミノ-9-(2-クロロ-6-メチル-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

参考例 5 で得られる化合物を用いて、実施例 11 と同様の方法で標記化合物を得た。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ 9.74 (1H, brs), 7.33 (1H, d, J = 5.8 Hz), 7.22 (1H, d, J = 5.8 Hz), 6.24 (1H, m), 6.06 (2H, brs), 4.83 (2H, s), 3.09 (2H, m), 2.42 (3H, s), 1.37 (2H, m), 1.25 (2H, m), 0.82 (3H, t, J = 5.5 Hz).

実施例 30: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(6-ヒドロキシ-3-ピリジルメチル) アデニン

参考例 5 で得られる化合物を用いて、実施例 11 と同様の方法で標記化合物を得た。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ 11.50 (1H, brs), 9.61 (1H, brs), 7.45 (1H, dd, J = 2.6, 9.5 Hz), 7.28 (1H, d, J = 2.6 Hz), 6.28 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.22 (1H, t, J = 6.2 Hz), 6.00 (2H, brs), 4.53 (2H, s), 3.17 (2H, q, J = 6.2 Hz), 1.45 (2H, m), 1.30 (2H, m), 0.88 (3H, t, J = 7.3 Hz).

実施例 31: 8-ヒドロキシ-2-(2-メトキシ)エトキシ-9-(3-ピリジルメチル) アデニン

対応する出発物質を用いて実施例 1 と同様の方法で標記化合物を得た。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ 10.02 (1H, brs), 8.57 (1H, s), 8.48 (1H, d, J = 4.8 Hz), 7.70 (1H, d, J = 6.1 Hz), 7.36 (1H, dd, J = 4.8, 6.1 Hz), 6.50 (2H, brs), 4.90 (2H, s), 4.27 (2H, t, J = 4.6 Hz), 3.59 (2H, t, J = 4.6 Hz), 3.27 (3H, s).

実施例 32: 8-ヒドロキシ-2-メトキシ-9-(3-ピリジルメチル) アデニン

実施例 1 と同様の方法で標記化合物を得た。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ 10.04 (1H, brs), 8.57 (1H, s), 8.48 (1H, d, J = 4.8 Hz), 7.71 (1H, d, J = 6.1 Hz), 7.35 (1H, dd, J = 4.8, 6.1 Hz), 6.53 (2H, brs), 4.90 (2H, s), 3.76 (3H, s).

実施例 33: 2-ブチルアミノ-8-エトキシカルボニルオキシ-9-(6-メトキシ-3-ピリジルメチル) アデニン

実施例 19 で得られる化合物 (200 mg, 0.58 mmol) の塩化メチレン溶液 (15 mL) に、トリエチルアミン (100  $\mu$ L, 0.75 mmol)、クロロギ酸エチル (67  $\mu$ L, 0.70 mmol)、ジメチルアミノピリジン (20 mg, 0.17 mmol) を順次加え、室温で 15 時間反応させた。反応液に水を加え有機層を抽出した。5% クエン酸水溶液、10% 食塩水で洗浄して無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去した。残渣にヘキサンを加え、固体を析出させて濾取し、白色粉末固体として標記化合物を 170 mg 得た (収率: 71%)。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.33 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 7.75 (1H, dd,  $J = 1.9, 8.4$  Hz), 6.15 (2H, brs), 6.67 (1H, d,  $J = 8.4$  Hz), 4.87 (2H, s), 4.71 (1H, brt,  $J = 5.4$  Hz), 4.46 (2H, q,  $J = 7.1$  Hz), 3.90 (3H, s), 3.41-3.34 (2H, m), 1.60-1.35 (7H, m), 0.96 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例 34: 2-ブチルアミノ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-エトキシカルボニルオキシアデニン

実施例 17 で得られる化合物とクロロギ酸エチルを用いて、実施例 33 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.55 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.81 (1H, dd,  $J = 2.4, 8.4$  Hz), 7.27 (1H, d,  $J = 8.4$  Hz), 6.06 (2H, brs), 4.93 (2H, s), 4.83 (1H, brt,  $J = 5.5$  Hz), 4.47 (2H, q,  $J = 7.1$  Hz), 3.40-3.32 (2H, m), 1.59-1.36 (7H, m), 0.95 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例 35: 2-ブチルアミノ-8-イソプロポキシカルボニルオキシ-9-(6-メトキシ-3-ピリジルメチル) アデニン

実施例 19 で得られる化合物とクロロギ酸イソプロピルを用いて、実施例 33 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.32 (1H, d,  $J = 2.2$  Hz), 7.74 (1H, dd,  $J = 2.2, 8.9$  Hz), 6.68 (1H, d,  $J = 8.9$  Hz), 6.08 (2H, brs), 5.23-5.13 (1H, m), 4.89 (1H, brt,  $J = 5.8$  Hz), 4.87 (2H, s), 3.91 (3H, s), 3.42-3.35 (2H, m), 1.60-1.52 (2H, m), 1.48-1.37 (8H, m), 0.96 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例 36: 2-ブチルアミノ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-イソプロポキシカルボニルオキシアデニン

実施例 17 で得られる化合物とクロロギ酸イソプロピルを用いて、実施例 33 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.55 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 7.80 (1H, dd,  $J = 1.9, 8.4$  Hz), 7.27 (1H, d,  $J = 8.4$  Hz), 6.14 (2H, brs), 5.24-5.14 (1H, m), 4.96-4.92 (3H, m), 3.40-3.33 (2H, m), 1.62-1.51 (2H, m), 1.45-1.34 (8H, m), 0.95 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例 37: 2-ブトキシ-8-エトキシカルボニルオキシ-9-(6-メトキシ-3-ピリジルメチル) アデニン

実施例 2 で得られる化合物とクロロギ酸エチルを用いて、実施例 3 3 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.33 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.75 (1H, dd,  $J = 2.4, 8.1$  Hz), 6.68 (1H, d,  $J = 8.1$  Hz), 6.15 (2H, brs), 4.93 (2H, s), 4.48 (2H, q,  $J = 7.1$  Hz), 4.30 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 3.90 (3H, s), 1.83-1.72 (2H, m), 1.53-1.43 (5H, m), 0.98 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例 3 8: 2-ブトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-エトキシカルボニルオキシアデニン 10

実施例 1 で得られる化合物とクロロギ酸エチルを用いて、実施例 3 3 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.56 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.81 (1H, dd,  $J = 2.4, 8.4$  Hz), 7.29 (1H, d,  $J = 8.4$  Hz), 7.28 (2H, brs), 4.99 (2H, s), 4.49 (2H, q,  $J = 7.0$  Hz), 4.28 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 1.81-1.71 (2H, m), 1.52-1.43 (5H, m), 0.97 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例 3 9: 2-ブトキシ-9-(2-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-エトキシカルボニルオキシアデニン 20

実施例 5 で得られる化合物とクロロギ酸エチルを用いて、実施例 3 3 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.37-8.35 (1H, m), 7.73-7.69 (1H, m), 7.41-7.37 (1H, m), 7.09 (2H, brs), 4.95 (2H, s), 4.39 (2H, q,  $J = 7.2$  Hz), 4.12 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 1.61-1.53 (2H, m), 1.37-1.29 (5H, m), 0.87 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例 4 0: 2-ブトキシ-8-メトキシカルボニルオキシ-9-(3-ピリジルメチル)アデニン 30

実施例 8 で得られる化合物とクロロギ酸メチルを用いて、実施例 3 3 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.77 (1H, d,  $J = 2.2$  Hz), 8.56-8.53 (1H, m), 7.85-7.81 (1H, m), 7.25 (2H, brs), 7.24-7.22 (1H, m), 5.02 (2H, s), 4.30 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 4.05 (3H, s), 1.82-1.72 (2H, m), 1.53-1.42 (2H, m), 0.97 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例 4 1: 2-ブトキシ-8-(n-ペンチルオキシ)カルボニルオキシ-9-(3-ピリジルメチル)アデニン 40

実施例 8 で得られる化合物とクロロギ酸 n-ペンチルを用いて、実施例 3 3 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.59 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 8.51-8.48 (1H, m), 7.75-7.72 (1H, m), 7.39-7.34 (1H, m), 7.07 (2H, brs), 4.92 (2H, s), 4.32 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 4.18 (2H, t,  $J = 6.5$  Hz), 1.71-1.61 (4H, m), 1.41-1.31 (6H, m), 0.93-0.85 (6H, m).

実施例 4 2 : 2-ブトキシ-8-(シクロヘキシルオキシ)カルボニルオキシ-9-(3-ピリジルメチル)アデニン

実施例 8 で得られる化合物とクロロギ酸シクロヘキシルを用いて、実施例 3 3 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.60 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 8.51-8.49 (1H, m), 7.76-7.72 (1H, m), 7.39-7.35 (1H, m), 7.07 (2H, brs), 4.96-4.93 (3H, m), 4.18 (2H, t,  $J = 6.5$  Hz), 1.86-1.58 (8H, m), 1.44-1.33 (6H, m), 0.91 (3H, t,  $J = 7.4$  Hz).

10

実施例 4 3 : 8-(アリルオキシ)カルボニルオキシ-2-ブトキシ-9-(3-ピリジルメチル)アデニン

実施例 8 で得られる化合物とクロロギ酸アリルを用いて、実施例 3 3 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.61 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 8.51-8.49 (1H, m), 7.77-7.74 (1H, m), 7.39-7.35 (1H, m), 7.25 (1H, dd,  $J = 6.5$ , 13.8 Hz), 7.03 (2H, brs), 5.06 (1H, dd,  $J = 1.9$ , 13.8 Hz), 4.93 (2H, s), 4.86 (1H, dd,  $J = 1.9$ , 6.5 Hz), 4.19 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 1.64-1.41 (2H, m), 1.39-1.33 (2H, m), 0.91 (3H, t,  $J = 7.4$  Hz).

20

実施例 4 4 : 8-アセチルオキシ-2-ブトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)アデニン

実施例 1 7 で得られる化合物と無水酢酸を用いて、実施例 3 3 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (CDCl $_3$ )  $\delta$  8.56 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.80 (1H, dd,  $J = 2.4$ , 8.4 Hz), 7.30 (1H, d,  $J = 8.4$  Hz), 7.28 (2H, brs), 5.00 (2H, s), 4.29 (2H, t,  $J = 6.5$  Hz), 2.72 (3H, s), 1.82-1.71 (2H, m), 1.52-1.42 (2H, m), 0.97 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

30

実施例 4 5 : 8-プロピオニルオキシ-2-ブトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)アデニン

実施例 1 7 で得られる化合物と塩化プロピオニルを用いて、実施例 3 3 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (CDCl $_3$ )  $\delta$  8.55 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.80 (1H, dd,  $J = 2.4$ , 8.1 Hz), 7.30 (1H, d,  $J = 8.1$  Hz), 7.28 (2H, brs), 5.00 (2H, s), 4.29 (2H, t,  $J = 6.5$  Hz), 3.14 (2H, q,  $J = 7.4$  Hz), 1.82-1.71 (2H, m), 1.55-1.42 (2H, m), 1.23 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.97 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

40

実施例 4 6 : 8-ベンゾイルオキシ-2-ブトキシ-9-(6-メチル-3-ピリジルメチル)アデニン

実施例 2 5 で得られる化合物と塩化ベンゾイルを用いて、実施例 3 3 と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (CDCl $_3$ )  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.77 (2H, d,  $J = 7.3$  Hz), 7.69 (1H, dd,  $J = 2.4$ , 8.1 Hz), 7.63 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 7.55 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 7.50 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 7.45 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 7.40 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 7.35 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 7.30 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 7.25 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 7.20 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 7.15 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 7.10 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 7.05 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 7.00 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.95 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.90 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.85 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.80 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.75 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.70 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.65 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.60 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.55 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.50 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.45 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.40 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.35 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.30 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.25 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.20 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.15 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.10 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.05 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 6.00 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.95 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.90 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.85 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.80 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.75 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.70 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.65 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.60 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.55 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.50 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.45 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.40 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.35 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.30 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.25 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.20 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.15 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.10 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.05 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 5.00 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.95 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.90 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.85 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.80 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.75 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.70 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.65 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.60 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.55 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.50 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.45 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.40 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.35 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.30 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.25 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.20 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.15 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.10 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.05 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 4.00 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.95 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.90 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.85 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.80 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.75 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.70 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.65 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.60 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.55 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.50 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.45 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.40 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.35 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.30 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.25 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.20 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.15 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.10 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.05 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 3.00 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.95 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.90 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.85 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.80 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.75 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.70 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.65 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.60 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.55 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.50 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.45 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.40 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.35 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.30 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.25 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.20 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.15 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.10 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.05 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 2.00 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.95 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.90 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.85 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.80 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.75 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.70 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.65 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.60 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.55 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.50 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.45 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.40 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.35 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.30 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.25 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.20 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.15 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.10 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.05 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 1.00 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.95 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.90 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.85 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.80 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.75 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.70 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.65 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.60 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.55 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.50 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.45 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.40 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.35 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.30 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.25 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.20 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.15 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.10 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.05 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.00 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz).

50

z), 7.49 (2H, t, J = 7.3 Hz), 7.09 (1H, d, J = 8.1 Hz), 5.76 (2H, brs), 4.95 (2H, s), 4.34 (2H, t, J = 6.6 Hz), 2.52 (3H, s), 1.78 (2H, m), 1.52 (2H, m), 0.99 (3H, t, J = 7.3 Hz).

実施例 47: 8-ベンゾイルオキシ-2-ブチルアミノ-9-(6-メチル-3-ピリジルメチル) アデニン

実施例 27 で得られる化合物と塩化ベンゾイルを用いて、実施例 33 と同様の方法で標記化合物を得た。

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 8.63 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.74 (2H, d, J = 7.4 Hz), 7.69 (1H, dd, J = 2.0, 7.9 Hz), 7.61 (1H, t, J = 7.4 Hz), 7.47 (2H, t, J = 7.4 Hz), 7.08 (1H, d, J = 7.9 Hz), 5.57 (2H, brs), 4.88 (2H, s), 4.84 (1H, t, J = 5.9 Hz), 3.40 (2H, m), 2.52 (3H, s), 1.58 (2H, m), 1.42 (2H, m), 0.97 (3H, t, J = 7.3 Hz).

実施例 48: 2-ブトキシ-8-(4-メチル)ベンゾイルオキシ-9-(6-メチル-3-ピリジルメチル) アデニン

実施例 25 で得られる化合物と塩化 p-トルオイルを用いて、実施例 33 と同様の方法で標記化合物を得た。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.44 (1H, s), 7.73 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.62 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.30 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.20 (1H, d, J = 8.0 Hz), 6.84 (2H, brs), 4.84 (2H, s), 4.22 (2H, t, J = 6.6 Hz), 2.42 (3H, s), 2.40 (3H, s), 1.66 (2H, m), 1.41 (2H, m), 0.92 (3H, t, J = 7.4 Hz).

実施例 49: 2-ブチルアミノ-8-(4-メチル)ベンゾイルオキシ-9-(6-メチル-3-ピリジルメチル) アデニン

実施例 27 で得られる化合物と塩化 p-トルオイルを用いて、実施例 33 と同様の方法で標記化合物を得た。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.43 (1H, s), 7.69 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.62 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.28 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.19 (1H, d, J = 8.0 Hz), 6.71 (1H, brs), 6.25 (2H, brs), 4.80 (2H, s), 3.22 (2H, t, J = 6.6 Hz), 2.42 (3H, s), 2.39 (3H, s), 1.46 (2H, m), 1.30 (2H, m), 0.89 (3H, t, J = 7.4 Hz).

実施例 50: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(1-ナフチルメチル) アデニン

参考例 5 で得られた化合物を用いて、実施例 11 と同様の方法で表記化合物を得た。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ 9.79 (1H, s), 8.39-8.41 (1H, m), 7.94-7.97 (1H, m), 7.83-7.86 (1H, m), 7.55-7.59 (2H, m), 7.40-7.46 (1H, m), 7.26 (1H, m), 6.17 (1H, t, J = 5.8 Hz), 6.05 (2H, s), 5.28 (2H, s), 3.09-3.16 (2H, m), 1.36-1.44 (2H, m), 1.21-1.29 (2H, m), 0.83 (3H, t, J = 7.4 Hz).

実施例 51: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(2-ナフチルメチル) アデニン

参考例 5 で得られた化合物を用いて、実施例 11 と同様の方法で表記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.69 (1H, s), 7.84-7.89 (3H, m), 7.74 (1H, s), 7.47-7.52 (3H, m), 6.21 (1H, t,  $J = 5.8$  Hz), 6.03 (2H, s), 4.97 (2H, s), 3.12-3.20 (2H, m), 1.41-1.46 (2H, m), 1.22-1.31 (2H, m), 0.83 (3H, t,  $J = 7.4$  Hz)

実施例 52: 2-ブトキシ-8-ヒドロキシ-9-(1-ナフチルメチル) アデニン

対応する出発物質を用いて、実施例 1 と同様の方法で表記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.21 (1H, s), 8.37-8.41 (1H, m), 7.85-7.98 (2H, m), 7.55-7.60 (2H, m), 7.41-7.47 (1H, m), 7.25-7.28 (1H, m), 6.52 (2H, s), 5.34 (2H, s), 4.10 (2H, d,  $J = 6.6$  Hz), 1.55-1.61 (2H, m), 1.29-1.38 (2H, m), 0.87 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz)

実施例 53: 2-ブトキシ-8-ヒドロキシ-9-(2-ナフチルメチル) アデニン

対応する出発物質を用いて、実施例 1 と同様の方法で表記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.12 (1H, s), 7.87-7.90 (3H, m), 7.76 (1H, s), 7.46-7.51 (3H, m), 6.45 (2H, s), 5.02 (2H, s), 4.14 (2H, d,  $J = 6.6$  Hz), 1.55-1.63 (2H, m), 1.31-1.39 (2H, m), 0.88 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz)

実施例 54: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(5-クロロ-2-チエニルメチル) アデニン

参考例 5 で得られた化合物を用いて、実施例 11 と同様の方法で表記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.85 (1H, s), 6.96 (1H, d,  $J = 3.8$  Hz), 6.91 (1H, d,  $J = 3.8$  Hz), 6.23 (1H, t,  $J = 5.4$  Hz), 6.07 (2H, s), 4.87 (2H, s), 3.15-3.23 (2H, m), 1.43-1.53 (2H, m), 1.24-1.37 (2H, m), 0.89 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz)

実施例 55: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(6-メチル-3-ピリジルメチル) アデニン ー硫酸塩

実施例 27 の化合物 (2.52 g, 7.70 mmol) のメタノール溶液 (520 ml) に 0.5 N 硫酸 (30.8 ml) を加え、析出した結晶を濾取し、標記化合物を得た。

mp 249-252 °C

Calc: C 45.17, H 5.45, N 23.04, S 7.54

Anal: C 44.96, H 5.56, N 22.90, S 7.53

実施例 56: マウス脾臓細胞におけるインターフェロン誘導作用 (in vitro)

C3H/HeJ 系マウス (雄性; 8-10 週齢) から脾臓を摘出し、5% FBS を含む MEM 培地を用いて  $2 \times 10^6$  cells/ml の脾細胞懸濁液を調製し、24 穴マイクロプレートの各ウェルに 0.5 ml ずつ分注した。そして、同培地で希釈した被験化合物 (0.2% DMSO を含む) を各ウェルに 0.5 ml ずつ添加し、5%  $\text{CO}_2$  インキュベーター内で 37 °C、24 時間培養した後、培養液を 0.2 マイクロメートルのフィルターで無菌ろ過して培養上清を得た。培養上清中のインターフェロン力価は J. A. Armstrong, Methods in Enzymology 78, 381-7 に記載のバイオアッセイにより定量した。すなわち  $1 \times 10^4$  cells/50

$\mu$ 1のマウス繊維芽細胞 L929を96穴の培養プレートで24時間培養後、50  $\mu$ 1の希釈培養上清を添加し、更に24時間培養した。続いて水泡性口内炎ウイルスを100  $\mu$ 1ずつ添加し、ウイルス感染後44時間での細胞変性効果をクリスタルバイオレット染色により確認した。定量は、色素を2%デオキシコール酸ナトリウム水溶液で溶解し、595 nmの吸収を測定することで行った。なお、参考化合物例1として、9-ベンジル-2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシアデニン(WO99-28321の実施例24の化合物)、参考化合物例2として、9-ベンジル-2-ブトキシ-8-ヒドロキシアデニン(WO99-28321の実施例19の化合物)、比較例1としてR-837(イミキモド)、比較例2としてR-848(1-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-2-メトキシエチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミン)を用いた。表2に各化合物の最少有効濃度を示す。

【表2】

インターフェロン誘導活性

化合物	最少有効濃度 (nM)	化合物	最少有効濃度 (nM)
実施例1	1	実施例18	10
実施例2	1	実施例19	3
実施例3	1	実施例20	30
実施例4	10	実施例21	3
実施例5	3	実施例22	10
実施例6	1	実施例23	10
実施例7	1	実施例24	3
実施例8	1	実施例25	1
実施例9	3	実施例26	1
実施例10	10	実施例27	3
実施例11	3	実施例28	10
実施例12	10	実施例29	10
実施例13	3	参考化合物1	100
実施例14	1	参考化合物2	1
実施例15	1	比較例1	300
実施例16	1	比較例2	3
実施例17	3		

実施例57： マウスにおけるインターフェロン誘導作用 (in vivo)

被験化合物を0.5%カルボキシメチルセルロース水溶液に懸濁し、Balb/c雄性マウスに経口投与した。2時間後心臓より採血し、血清中のインターフェロン力価を実施例56と同様の方法で測定した。表3に結果を示す。

【表3】



インターフェロン誘導活性 (U/ml)

	投与量 (mg/kg)			
	0.01	0.03	0.1	0.3
実施例1		123±87	322±95	623±32
実施例2	25±17	388±87	1211±263	2559±495
実施例3			353±73	1966±532
実施例5			133±33	473±9
実施例6			569±42	1222±248
実施例7			347±149	845±22
実施例8	13±5	167±97	725±141	936±438
実施例9				539±107
実施例10		89±22	409±267	733±256
実施例11			279±177	568±160
実施例12				31±5
実施例13				304±138
実施例14				570±63
実施例15			52±32	603±147
実施例16			251±46	716±155
実施例17		31±23	183±43	999±379
実施例18				94±49
実施例19	14±5	199±84	383±122	601±187
実施例21		15±8	290±134	571±164
実施例22			21±9	332±83
実施例23			42±7	414±118
実施例24				403±146
実施例25	65±52	151±29	753±140	721±299
実施例26		121±11	433±366	780±190
実施例27		14±3	324±66	804±274
実施例28			186±62	1462±260
実施例29				619±268
参考化合物1			55±25	275±165
参考化合物2		60±40	186±42	317±160
比較例2			1638±246	1961±950

10

20

30

## 実施例58： カニクイザルにおけるインターフェロン誘導作用 (in vivo)

被験化合物を0.5%カルボキシメチルセルロース水溶液に懸濁し、10 mg/kgを雄性カニクイザル1群5匹に経口投与した。経時的に採血し、血清中のインターフェロン力価は実施例56と同様の方法で測定した。投与4時間後における血清中のインターフェロン力価(平均値±SE)は、実施例17が13,876±825 U/ml、実施例19が12,173±6619 U/ml、実施例27が14,488±6365 U/ml、参考例2が18,305±5578 U/mlであり、ほぼ同等のインターフェロン誘導作用が認められた。しかしながら、参考例2では5匹中4例で嘔吐が認められたのに

40

## 実施例59： ヒト末梢血単核球細胞(PBMC)におけるインターフェロン誘導作用

健常ボランティア5名の末梢血をヘパリン加採血し、Lymphoprep<sup>TM</sup>(NYC OMED PHARMA AS)を用いた密度勾配遠心分離により単核球細胞(PBMC)を調製した。PBMCを無血清 RPMI 1640培地で2回洗浄した後、10%ウシ胎仔血清添加 RPMI 1640培地で $1 \times 10^6$ 個/mlに調製し、ジメチルスルホキシド(終濃度0.1%)に溶解した被験化合物の存在下で5% CO<sub>2</sub>インキュベータ内で37℃にて24時間培養した。なお、対照には被験化合物を含まない0.1%ジメチルスルホキシドを用いた。培養上清を無菌濾過により回収し、IFN誘導活性の測定実験に供するまで-20℃以下で凍結保存した。培養上清中のヒトIFN- $\alpha$ の定量はアマ

50

シャム社の高感度 E L I S A s y s t e m を使用した。表 4 に結果を示す。(－) は検出限界 ( $1.25 \text{ pg/ml}$ ) 以下、N T は未試験を意味する。

【表 4】

インターフェロン誘導活性 (pg/ml)

	濃度 (nM)				
	0.3	1	3	10	30
実施例17	NT	$5 \pm 3$	$17 \pm 17$	$50 \pm 33$	$61 \pm 38$
実施例19	NT	$5 \pm 1$	$12 \pm 11$	$48 \pm 34$	$60 \pm 33$
実施例25	$7 \pm 3$	$28 \pm 24$	$46 \pm 34$	NT	NT
実施例27	NT	$6 \pm 3$	$26 \pm 22$	$56 \pm 37$	$59 \pm 33$
比較例2	－	－	$6 \pm 5$	NT	NT
参考化合物2	NT	－	7	$23 \pm 22$	$64 \pm 40$

10

#### 実施例 60： 感作脾臓細胞からの T h 2 サイトカイン産生抑制作用

7 週齢の B A L B / c マウスに、 $10 \mu\text{g}$  のオボアルブミンを吸着させた  $4 \text{ mg}$  の水酸化アルミニウムゲル ( $100 \mu\text{l}$ ) を腹腔内投与して免疫し、14 日後同剤で追加免疫した。その7日後、脾臓を取りだし、非働化牛胎児血清 (10%)、2-メルカプトエタノール ( $50 \mu\text{l}$ )、ペニシリン G ( $100 \text{ U/ml}$ )、ストレプトマイシン ( $100 \mu\text{g/ml}$ ) を含む R P M I - 1 6 4 0 に懸濁し、脾細胞浮遊液を調製した。脾細胞浮遊液 ( $5 \times 10^6 \text{ cell} / 200 \mu\text{l} / \text{well}$ ) にオボアルブミン ( $0.5 \text{ mg/ml}$ ) および試験化合物を添加し、 $37^\circ\text{C}$ 、5%  $\text{CO}_2$  存在下で3日間培養した。培養上清中のサイトカイン量を E L I S A 法により定量した。I F N -  $\gamma$  および I L - 4 はアマシャム社、I L - 5 はエンドジェン社のキットを使用した。表 5 に結果を示す。

20

【表 5】

IL-4産生阻害作用 (% of control)

	濃度 (nM)			
	0.1	1	10	100
実施例1	98	7	2	<1
実施例2	96	4	<1	<1
実施例10	-	54	3	<1
実施例17	-	40	<1	<1
実施例19	-	32	<1	<1
実施例20	-	106	23	2
実施例21	-	53	1	<1
実施例22	-	88	9	1
実施例25	86	2	<1	<1
実施例27	-	30	1	<1
比較例1	-	18	1	<1
比較例2	90	24	1	<1
参考化合物1	-	-	109	24
参考化合物2	107	48	1	<1

10

20

IL-5産生阻害作用 (% of control)

	濃度 (nM)			
	0.1	1	10	100
実施例1	116	41	16	15
実施例2	98	37	14	12
実施例10	-	91	32	15
実施例17	-	77	24	10
実施例19	-	83	16	13
実施例20	-	106	71	19
実施例21	-	97	23	15
実施例22	-	115	50	18
実施例25	102	31	13	13
実施例27	-	68	20	12
比較例1	-	54	15	10
比較例2	106	73	18	10
参考化合物1	-	-	92	69
参考化合物2	99	79	16	11

30

40

## 実施例61： ラットにおける消化管吸収性

被験化合物を0.5%カルボキシメチルセルロース水溶液に懸濁し、SD系雄性ラットに経口投与した。経時的に採血し、血中の薬物濃度をHPLCにて測定した。下表にそのCmaxおよびTmaxを示す。

【表6】

## CmaxおよびTmax

	Dose (mg/kg)	Cmax (ng/ml)	Tmax (hr)
実施例17	3	310	1
実施例19	3	188	4
実施例25 の塩酸塩	3	18	1
	10	150	0.25
実施例27	3	565	0.5
比較例1	3	90	0.5
比較例2	3	19	1
	10	15	0.5

10

実施例62：溶解度

5.53%クエン酸（1水和物）と、1.75%リン酸二ナトリウム（無水）を混合し調整した緩衝液（pH 2.5, 5.5, 7.4）に化合物を添加し、ボルテックスミキサーで攪拌、超音波で30分処理した後、再度ボルテックスミキサーで攪拌し、遠心分離（15,000rpm, 20min）する。その後、上澄中の化合物濃度をHPLCで定量した。下表にその濃度を示す。

20

【表7】

(μg/ml)

	pH 2.5	pH 5.5	pH 7.4
実施例 8	784	20	18
実施例 9	350	4	3
実施例 10	34	15	10
実施例 15	140	1	<1
実施例 16	293	NT	NT
実施例 19	130	2	2
実施例 20	8,813	NT	NT
実施例 21	15,000	45	64
実施例 22	>80,000	73	16
実施例 24	27,000	22	1
実施例 25	>1,000	5	3
実施例 26	>1,000	6	3
実施例 27	610	5	2
実施例 28	>1,000	8	4
実施例 31	>1,000	353	322
実施例 32	>1,000	82	25
参考化合物 1	26	<1	<1
参考化合物 2	2	<1	<1

10

20

# 実施例 63 : ラット好酸球浸潤モデルにおける実施例 27 の化合物の薬効評価

30

day 0 および day 7 に卵白アルブミン (OVA) 1 mg と Al(OH)<sub>3</sub> 100 mg を含む溶液をラット腹腔内に 1 ml 投与し免疫を行い、day 14 に 1% OVA 溶液を超音波ネブライザーにて 15 分間噴霧し反応を惹起した。被験化合物の投与は惹起 2.5 時間前の気管内投与とし、惹起 24 時間後に気管支肺胞洗浄を行い洗浄液中の好酸球を Hinkelman 染色し、その数をカウントした。対照として Sensi-/Challe.+、CMC-Na 及び Fluticasone を用いた。図 1 及び下表にその結果を示す。

【表 8】

化合物 (気管内投与)	x 10 <sup>4</sup> cells		
	平均	標準偏差	標準誤差
Sensi-/Challe.+	26.22	15.60	6.37
CMC-Na	319.55	281.89	115.08
実施例 27 0.001mg/kg	383.85	392.01	160.04
実施例 27 0.01mg/kg	186.77	161.86	66.08
実施例 27 0.1mg/kg	46.84	51.84	21.16
Fluticasone 0.01mg/kg	300.07	231.84	94.65

40

# 実施例 64 : マウス能動皮膚アナフィラキシーモデルにおける実施例 17 の化合物の薬効評価

day 0 に卵白アルブミン (OVA) 2 μg と Al(OH)<sub>3</sub> 5 mg を含む溶 50

液をマウス腹腔内に  $500 \mu\text{l}$  投与し免疫を行い、day 14 にエーテル麻酔維持下で  $1 \text{ mg/ml}$  の OVA 溶液を左耳介に  $20 \mu\text{l}$  皮内注射し反応を惹起した。被験化合物は惹起 2 時間前に左耳介の表裏に  $10 \mu\text{l}$  ずつ塗布し、惹起 24 時間後の耳介厚の測定をマイクロメータを用いて行った。対照としてアセトンを用いた。図 2 及び下表にその結果を示す。

【表 9】

化合物	耳腫脹 (mm)		
	平均	標準偏差	標準誤差
アセトン	0.034	0.021	0.009
実施例 17 $4 \mu\text{g/ear}$	0.046	0.024	0.010
実施例 17 $40 \mu\text{g/ear}$	0.048	0.013	0.005
実施例 17 $400 \mu\text{g/ear}$	0.014	0.008	0.003

10

#### 実施例 65：担癌モデルマウスにおける実施例 27 の化合物の抗腫瘍効果

6 週齢の雄 BALB/c マウス（日本チャールス・リバー）の左腹部にマウス腎癌由来 Renca 細胞株（岩手医大より入手）を  $5 \times 10^4 \text{ cells}/0.05 \text{ ml/mouse}$  で皮内移植した。翌日に体重測定を行い、体重の平均値がほぼ同等になるように 6 匹ずつ 5 群に分け、ビークル（0.5%カルボキシメチルセルロース（以下、CMC-Na と記載する）水溶液）、 $1 \text{ mg/kg}$  及び  $3 \text{ mg/kg}$  の実施例 27 の化合物を、経口ゾンテを用いて強制経口投与し（ $10 \text{ ml/kg}$ ）、またマウス当たり  $1 \times 10^4 \text{ U}/0.1 \text{ ml}$  及び  $5 \times 10^4 \text{ U}/0.1 \text{ ml}$  のマウスインターフェロン  $\alpha$ （以下、mIFN- $\alpha$  と記載する）を背部に皮下投与した。投与は 4 日毎に 5 回実施した。形成された腫瘍の長径 [L] (mm) 及び短径 [W] (mm) を週 2 回計測し、腫瘍容積 [V] ( $\text{mm}^3$ ) を算出した ( $V = L \times W^2$ )。また、Steel の多重比較により有意差検定を行った。検定には The SAS system for Windows（登録商標）Release 8.01 (SAS Institute Inc., Cary, NC, USA) を使用した。

20

移植から約 30 日の観察期間を設け、腫瘍容積ならびに体重をモニターし、Renca 細胞株に対する抗腫瘍効果を評価した。薬剤の種類ごとにビークル投与と比較した腫瘍容積の平均値 ( $n = 6$ ) を図 3 に示した。その結果、実施例 27 の化合物及び mIFN- $\alpha$  投与群はビークル投与群に比べ腫瘍容積が有意に小さく ( $P < 0.05$ )、実施例 27 の化合物投与は mIFN- $\alpha$  投与と同等以上の抗腫瘍効果を示すことがわかった。

30

#### 実施例 66：自然転移モデルマウスにおける実施例 27 の化合物の抗腫瘍効果（転移抑制効果）

6 週齢の雌 B6C3F1 マウス（日本チャールス・リバー）の臀部に、マウスリンパ節高転移性卵巣癌由来 OV2944-HM-1 細胞株（広島大より入手）を  $1 \times 10^6 \text{ cells}/0.05 \text{ ml/mouse}$  で皮内移植した。移植 10 日後、ネブタール麻酔下で原発腫瘍を切除した。切除部に外科用接着剤（アロンアルファ）を塗布し、ウンドクリップにて断端を縫合した。翌日に体重測定を行い、体重の平均値がほぼ同等になるように各群 6 匹ずつ 3 群に分け、ビークル（0.5% CMC-Na 水溶液）、及び  $3 \text{ mg/kg}$  の実施例 27 の化合物を、経口ゾンテを用いて強制経口投与し（ $10 \text{ ml/kg}$ ）、また  $5 \times 10^4 \text{ U}/0.1 \text{ ml/mouse}$  の mIFN- $\alpha$  を背部に皮下投与した。投与は 4 日毎に 5 回実施した。移植後 35 日目に所属リンパ節（鼠頸、上腕、腋窩）を摘出し、その湿重量を測定した。同時に肺を摘出し、転移の有無を肉眼観察した。また、Steel の多重比較により有意差検定を行った。検定には The SAS system for Windows（登録商標）Release 8.01 (SAS Institute Inc., Cary, NC, USA) を使用した。

40

図 4 に示したように、最も大きい転移巣は原発腫瘍に近い鼠頸リンパ節であり、続いて腋窩リンパ節、上腕リンパ節の順であった。実施例 27 の化合物投与群は、ビークル投与群に比べ各転移リンパ節重量が小さく、転移抑制効果を示した。また、HM-1 細胞株はリ

50

リンパ節転移のみならず高頻度に肺転移が認められる。このことから、肺転移について検討した。下表に示したように、ピークル群では肉眼的所見で肺転移が6匹中5匹に認められたが、実施例27の化合物では全く認められなかった。このように実施例27の化合物はリンパ節転移の抑制に加え、強い肺転移抑制効果を有することが示された。一方、m I F N- $\alpha$ はリンパ節転移を抑制せず、肺転移の頻度もピークル群のそれと変わらなかった。

【表10】

	6匹中肺転移の認められた匹数
ピークル	5
マウスインターフェロン $\alpha$	5
実施例27の化合物	0

10

#### 実施例67：製剤例

常法により次の組成からなる錠剤を製造した。

実施例25の化合物	10mg
乳糖	600mg
でん粉	250mg
ヒドロキシプロピルセルロース	30mg
ステアリン酸カルシウム	5mg

20

#### 実施例68：製剤例

常法により次の組成の固体分散剤を作成した。

実施例27の化合物	20mg
ニコール（界面活性剤）	5mg
ヒドロキシプロピルセルロース	200mg
メタノール	2ml
ジクロロメタン	2ml

本明細書で引用した全ての刊行物をそのまま参考として本明細書中にとり入れるものとする。 30

#### 【0025】

##### 【発明の効果】

本発明のアデニン誘導体は選択的かつ際だったインターフェロン誘導活性を有する。本発明のアデニン誘導体は、生体内でインターフェロンの分泌を促進するので、インターフェロンが有効な疾患、例えばB型及びC型肝炎、エイズなどのウイルス疾患、癌疾患などの予防又は治療に有用である。本発明のアデニン誘導体は低分子であるので、インターフェロン製剤とは異なり経口投与が可能であり、しかも水溶性に優れ消化管吸収率が高い化合物である。更に、本発明のアデニン誘導体はTh2細胞から放出されるIL-4、IL-5などの炎症性サイトカインの産生を選択的に阻害するため、喘息、アトピー性皮膚炎などのTh2細胞が深く関与している疾患の予防又は治療薬として有用である。 40

#### 【0026】

##### 【図面の簡単な説明】

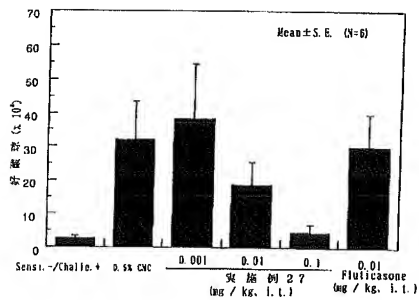
【図1】図1は、ラット好酸球浸潤モデルにおける本発明の化合物の薬効評価試験の結果を示す図である。

【図2】図2は、マウス能動皮膚アナフィラキシーモデルにおける本発明の化合物の薬効評価試験の結果を示す図である。

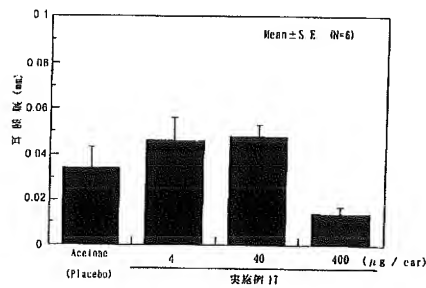
【図3】図3は、実施例65に記載の抗腫瘍効果試験の結果を示す図である。実施例27の化合物、及びマウスインターフェロン $\alpha$ のそれぞれについて腫瘍容積をピークル（対照群）と比較した。 50

【図 4】 図 4 は、実施例 6 6 に記載の抗腫瘍効果（転移抑制効果）試験の結果を示す図である。ビークル（対照群）、マウスインターフェロン $\alpha$  及び実施例 2 7 の化合物の各投与群について各リンパ節の湿重量を比較した。

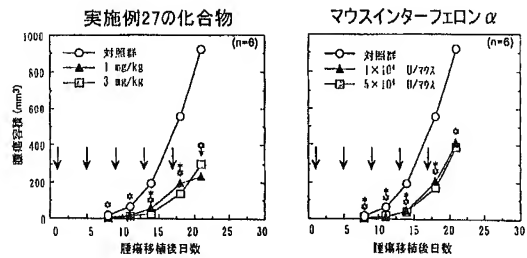
【図 1】



【図 2】

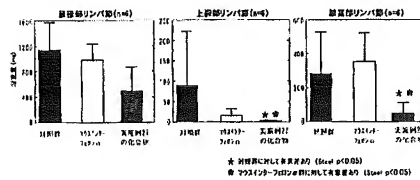


【図 3】



●● 対照群に対して有意差あり (Steel:  $p < 0.05$ )

【図 4】



● 対照群に相比して有意差あり (Steel:  $p < 0.05$ )  
 ● マウスインターフェロンα群に相比して有意差あり (Steel:  $p < 0.05$ )



---

 フロントページの続き
(51)Int.Cl.<sup>7</sup>

F I

テーマコード (参考)

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 473/34

C 0 7 D 473/34 3 2 1

(72)発明者 萩野 哲広

大阪府豊中市曽根東町2-10-4-433

(72)発明者 栗本 歩

兵庫県神戸市東灘区森北町3丁目4-30-103

(72)発明者 川上 肇

兵庫県西宮市鷺林寺南町16-11

 Fターム(参考) 4C086 AA01 AA02 CB07 MA01 MA04 NA14 ZA75 ZB08 ZB13 ZB26  
 ZB33 ZC41 ZC55

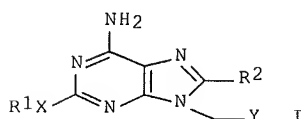
L1 ANSWER 1 OF 1 CAPLUS COPYRIGHT 2009 ACS on STN  
 AN 2004:391220 CAPLUS Full-text  
 DN 140:400029  
 ED Entered STN: 14 May 2004  
 TI Pharmaceuticals containing adenines as interferon inducers and Th2  
 cell-selective immunosuppressants for treatment of viral infection, tumor,  
 or inflammation  
 TIJP 新規アデニン誘導体を有効成分として含有する医薬 [原題]  
 IN Isobe, Yoshiaki; Ogita, Haruhisa; Tobe, Masanori; Takahisa, Haruo; Ogino,  
 Tetsuhiro; Kurimoto, Ayumi; Kawakami, Hajime  
 PA Sumitomo Pharmaceutical Co., Ltd., Japan  
 SO Jpn. Kokai Tokkyo Koho, 133 pp.  
 CODEN: JKXXAF  
 DT Patent  
 LA Japanese  
 IC ICM A61K031-52  
 ICS A61K031-5377; A61P031-14; A61P031-18; A61P031-20; A61P035-00;  
 A61P037-06; A61P037-08; A61P043-00; C07D473-34  
 CC 1-5 (Pharmacology)  
 Section cross-reference(s): 28, 63  
 FAN.CNT 1  

PATENT NO.	KIND	DATE	APPLICATION NO.	DATE
PI JP 2004137157	A	20040513	JP 2002-301195	20021016 <--
PRAI JP 2002-301195		20021016		

 CLASS  

PATENT NO.	CLASS	PATENT FAMILY CLASSIFICATION CODES
JP 2004137157	ICM	A61K031-52
	ICS	A61K031-5377; A61P031-14; A61P031-18; A61P031-20; A61P035-00; A61P037-06; A61P037-08; A61P043-00; C07D473-34
	IPCI	A61K0031-52 [ICM,7]; A61K0031-519 [ICM,7,C*]; A61K0031-5377 [ICS,7]; A61K0031-5375 [ICS,7,C*]; A61P0031-14 [ICS,7]; A61P0031-18 [ICS,7]; A61P0031-20 [ICS,7]; A61P0031-00 [ICS,7,C*]; A61P0035-00 [ICS,7]; A61P0037-06 [ICS,7]; A61P0037-08 [ICS,7]; A61P0037-00 [ICS,7,C*]; A61P0043-00 [ICS,7]; C07D0473-34 [ICS,7]; C07D0473-00 [ICS,7,C*]
	IPCR	A61K0031-519 [I,C*]; A61K0031-52 [I,A]; A61K0031-5375 [I,C*]; A61K0031-5377 [I,A]; A61P0031-00 [I,C*]; A61P0031-14 [I,A]; A61P0031-18 [I,A]; A61P0031-20 [I,A]; A61P0035-00 [I,A]; A61P0035-00 [I,C*]; A61P0037-00 [I,C*]; A61P0037-06 [I,A]; A61P0037-08 [I,A]; A61P0043-00 [I,A]; A61P0043-00 [I,C*]; C07D0473-00 [I,C*]; C07D0473-34 [I,A]
	FTERM	4C086/AA01; 4C086/AA02; 4C086/CB07; 4C086/MA01; 4C086/MA04; 4C086/NA14; 4C086/ZA75; 4C086/ZB08; 4C086/ZB13; 4C086/ZB26; 4C086/ZB33; 4C086/ZC41; 4C086/ZC55

 OS MARPAT 140:400029  
 GI



AB Title pharmaceuticals, which are water soluble and show good absorption from the digestive tract after oral administration unlike interferon, contain adenines I [X = NH, C1-3 alkylimino, O, S; R1 = (un)substituted alkyl, (un)substituted alkenyl, (un)substituted alkynyl, (un)substituted (hetero)aryl; R2 = OH, SH, C1-8 acyloxy, C2-8 alkoxy carbonyloxy; Y = (un)substituted naphthalene, (un)substituted aromatic heterocyclyl], their tautomers, or their pharmacol. acceptable salts as active ingredients. Thus, 2-butoxy-9-(6-chloro-3-pyridylmethyl)-8-hydroxyadenine at  $\geq 1$  nM induced interferon formation in mouse fibroblast cell line L929 infected with vesicular stomatitis virus.

ST adenine prepn antitumor antiinflammatory antiviral oral; interferon inducer adenine prepn; Th2 selective immunosuppressant adenine prepn

IT T cell (lymphocyte)  
(helper cell/inducer, TH2; oral antiviral, antitumor, and anti-inflammatory agents containing adenines as interferon inducers and Th2 cell-selective immunosuppressants)

IT Anti-inflammatory agents  
(nonsteroidal; oral antiviral, antitumor, and anti-inflammatory agents containing adenines as interferon inducers and Th2 cell-selective immunosuppressants)

IT Allergy  
Allergy inhibitors  
Antitumor agents  
Antiviral agents  
Human  
Immunosuppressants  
Inflammation  
Neoplasm  
(oral antiviral, antitumor, and anti-inflammatory agents containing adenines as interferon inducers and Th2 cell-selective immunosuppressants)

IT Interferons  
RL: BSU (Biological study, unclassified); BIOL (Biological study)  
(oral antiviral, antitumor, and anti-inflammatory agents containing adenines as interferon inducers and Th2 cell-selective immunosuppressants)

IT Infection  
(viral; oral antiviral, antitumor, and anti-inflammatory agents containing adenines as interferon inducers and Th2 cell-selective immunosuppressants)

IT 473930-12-0P 473930-14-2P 473930-22-2P  
RL: BSU (Biological study, unclassified); PAC (Pharmacological activity); RCT (Reactant); SPN (Synthetic preparation); THU (Therapeutic use); BIOL (Biological study); PREP (Preparation); RACT (Reactant or reagent); USES (Uses)  
(oral antiviral, antitumor, and anti-inflammatory agents containing adenines as interferon inducers and Th2 cell-selective immunosuppressants)

IT 473929-96-3P 473929-97-4P 473930-00-6P 473930-03-9P 473930-06-2P 473930-20-0P  
RL: PAC (Pharmacological activity); RCT (Reactant); SPN (Synthetic preparation); THU (Therapeutic use); BIOL (Biological study); PREP (Preparation); RACT (Reactant or reagent); USES (Uses)  
(oral antiviral, antitumor, and anti-inflammatory agents containing adenines as interferon inducers and Th2 cell-selective immunosuppressants)

IT 473929-98-5P 473929-99-6P 473930-01-7P 473930-02-8P 473930-04-0P  
473930-05-1P 473930-07-3P 473930-08-4P 473930-09-5P 473930-10-8P  
473930-11-9P 473930-13-1P 473930-15-3P 473930-16-4P 473930-17-5P  
473930-18-6P 473930-19-7P 473930-21-1P 473930-23-3P 473930-24-4P  
473930-25-5P 473930-26-6P 473930-27-7P 473930-28-8P 473930-29-9P  
473930-30-2P 473930-31-3P 473930-32-4P 473930-33-5P 473930-34-6P

473930-35-7P 473930-36-8P 473930-37-9P 473930-38-0P 473930-39-1P  
473930-40-4P 473930-41-5P 473930-42-6P 473930-43-7P 473930-44-8P  
473930-45-9P 473930-46-0P 473930-47-1P 473930-48-2P 473930-49-3P  
473930-50-6P

RL: PAC (Pharmacological activity); SPN (Synthetic preparation); THU  
(Therapeutic use); BIOL (Biological study); PREP (Preparation); USES  
(Uses)

(oral antiviral, antitumor, and anti-inflammatory agents containing  
adenines as interferon inducers and Th2 cell-selective  
immunosuppressants)

IT 71-36-3, Butanol, reactions 79-03-8, Propionyl chloride 98-88-4,  
Benzoyl chloride 108-23-6, Isopropyl chloroformate 109-73-9,  
Butylamine, reactions 110-89-4, Piperidine, reactions 110-91-8,  
Morpholine, reactions 123-75-1, Pyrrolidine, reactions 541-41-3, Ethyl  
chloroformate 638-41-5, n-Pentyl chloroformate 874-60-2, p-Toluoyl  
chloride 1839-18-5, 2-Chloroadenine 2937-50-0, Allyl chloroformate  
6959-48-4, 3-Chloromethylpyridine hydrochloride 13248-54-9, Cyclohexyl  
chloroformate 70258-18-3, 2-Chloro-5-chloromethylpyridine

RL: RCT (Reactant); RACT (Reactant or reagent)

(oral antiviral, antitumor, and anti-inflammatory agents containing  
adenines as interferon inducers and Th2 cell-selective  
immunosuppressants)

IT 5463-09-2P 473930-51-7P 473930-52-8P 473930-53-9P 473930-54-0P  
473930-55-1P 473930-56-2P 473930-57-3P

RL: RCT (Reactant); SPN (Synthetic preparation); PREP (Preparation); RACT  
(Reactant or reagent)

(oral antiviral, antitumor, and anti-inflammatory agents containing  
adenines as interferon inducers and Th2 cell-selective  
immunosuppressants)

OSC.G 3 THERE ARE 3 CAPLUS RECORDS THAT CITE THIS RECORD (3 CITINGS)

UPOS.G Date last citing reference entered STN: 16 Feb 2009

OS.G CAPLUS 2008:1157747; 2007:350217; 2007:350028